

日本国特許庁  
JAPAN PATENT OFFICE

13.08.2004

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日 2003年 8月14日  
Date of Application:

出願番号 特願2003-293590  
Application Number:  
[ST. 10/C]: [JP 2003-293590]

REC'D 30 SEP 2004

WIPO

PCT

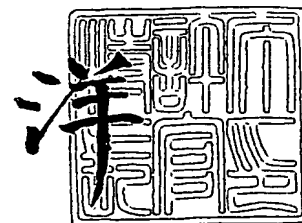
出願人 旭化成ファーマ株式会社  
Applicant(s):

PRIORITY DOCUMENT  
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN  
COMPLIANCE WITH  
RULE 17.1(a) OR (b)

2004年 9月16日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

小川



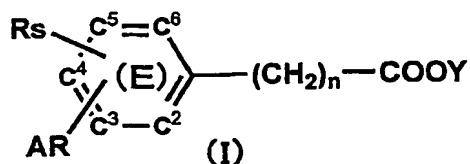
【書類名】 特許願  
【整理番号】 A31483M  
【提出日】 平成15年 8月14日  
【あて先】 特許庁長官 殿  
【発明者】  
    【住所又は居所】 静岡県富士市鮫島2番地の1 旭化成株式会社内  
    【氏名】 正田 基  
【発明者】  
    【住所又は居所】 静岡県富士市鮫島2番地の1 旭化成株式会社内  
    【氏名】 栗山 浩  
【特許出願人】  
    【識別番号】 000000033  
    【氏名又は名称】 旭化成株式会社  
【代理人】  
    【識別番号】 110000109  
    【氏名又は名称】 特許業務法人特許事務所サイクス  
    【代表者】 今村 正純  
【手数料の表示】  
    【予納台帳番号】 170347  
    【納付金額】 21,000円  
【提出物件の目録】  
    【物件名】 特許請求の範囲 1  
    【物件名】 明細書 1  
    【物件名】 要約書 1  
    【包括委任状番号】 0308322

## 【書類名】特許請求の範囲

## 【請求項 1】

一般式 (I) :

## 【化 1】



[式中、n は 1 ～ 3 の何れかの整数を示す。

芳香環 (E) 上の C<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、及び C<sup>6</sup> はそれぞれ独立に環構成炭素原子を示す。R<sub>s</sub> 又は A<sub>R</sub> が結合していない上記環構成炭素原子のうちのいずれか 1 個は V で置き換えられていてもよい。

V は窒素原子を示すか、あるいは Z<sub>x</sub> で置換された炭素原子を示す。Z<sub>x</sub> は、炭素数 1 ～ 4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、-OR<sup>9</sup>、又は -N(R<sup>n1</sup>)(R<sup>n2</sup>) を示す。R<sup>9</sup> は水素原子、炭素数 1 ～ 4 個の低級アルキル基、又は -A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub> を示す。ただし A<sup>6</sup> は単結合又はメチレンを示し、Q<sub>p</sub> はフェニル基を示し、該フェニル基は 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されていてもよい。T<sup>1</sup> は炭素数 1 ～ 4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数 1 ～ 4 個のアルコキシ基、炭素数 1 ～ 4 個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。R<sup>n1</sup> は水素原子又は炭素数 1 ～ 4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基を示し、R<sup>n2</sup> は R<sup>n1</sup> と同義であるか、あるいは -COR<sup>23</sup> 若しくは -SO<sub>2</sub>R<sup>24</sup> を示すか、又は R<sup>n1</sup> と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに 3 ～ 6 員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。R<sup>23</sup> は水素原子、炭素数 1 ～ 4 個の低級アルキル基、炭素数 1 ～ 4 個の低級アルコキシ基、-O-A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub>、又は -N(R<sup>25</sup>)(R<sup>26</sup>) を示す。R<sup>25</sup> は水素原子、炭素数 1 ～ 4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基を示す。R<sup>26</sup> は R<sup>25</sup> と同義であるか、あるいは R<sup>25</sup> と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに 3 ～ 6 員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。R<sup>24</sup> は炭素数 1 ～ 4 個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数 1 ～ 4 個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。

R<sub>s</sub> は -D-R<sub>x</sub> 又は -N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>) を示す。

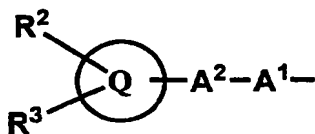
D は単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は -C(O)- を示す。

R<sub>x</sub> は炭素数 3 ～ 8 個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基を示すか、あるいは次式：



で表される R<sub>a</sub>、次式：

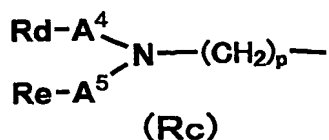
## 【化 2】



(Rb)

で表される R<sub>b</sub>、又は次式：

## 【化3】



で表される R c を示す。R a 中の k は 0 又は 1～3 の何れかの整数を示す。R<sup>1</sup> は炭素数 3～7 個の環状飽和アルキル基又は炭素数 6～8 個の縮合環式飽和アルキル基を示し、R<sup>1</sup> は 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の炭素数 1～4 の低級アルキル基で置換されていてもよい。R b 中の Q は部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環 (q) を示し、環上の任意の位置で A<sup>2</sup> と結合する。複素環 (q) は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を 1～4 個含む。A<sup>1</sup> は単結合又は炭素数 1～3 個のアルキレン (a) を示し、アルキレン (a) は炭素数 1～4 個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されていてもよい。A<sup>2</sup> は単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は -N(R<sup>4</sup>)- を示す (ただし A<sup>2</sup> が酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>- 又は -N(R<sup>4</sup>)- を示すときには、A<sup>1</sup> はエチレン又はトリメチレンを示す)。R<sup>2</sup> 及び R<sup>3</sup> はそれぞれ独立に水素原子、炭素数 1～4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、-OR<sup>5</sup>、-N(R<sup>6</sup>)(R<sup>6'</sup>)、-NHCOR<sup>7</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、又は -A<sup>6</sup>-Q a を示すか、あるいはそれらが互いに繋がってメチレンジオキシ基を示す。Q a は部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環 (q a) を示し、環上の任意の位置で A<sup>6</sup> と結合し、1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されていてもよい。複素環 (q a) は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を 1～4 個含む。R<sup>4</sup> 及び R<sup>6</sup> はそれぞれ独立に水素原子又は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示す。R<sup>5</sup> 及び R<sup>7</sup> はそれぞれ独立に水素原子、炭素数 1～4 個の低級アルキル基、又は -A<sup>6</sup>-Q a を示す。R<sup>8</sup> は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示す。R<sup>6'</sup> は R<sup>6</sup> と同義であるか、あるいは R<sup>6</sup> と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに 3～6 員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。R c 中の p は 2～4 の何れかの整数を示す。A<sup>4</sup> は単結合、メチレン、又はエチレンを示す。A<sup>5</sup> は -C(O)-、-C(S)-、又は -S(O)<sub>2</sub>- を示す。R d は水素原子、炭素数 1～8 個のアルキル基、又は Q a を示す。R e は炭素数 1～8 個のアルキル基、-A<sup>6</sup>-Q a、-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>R<sup>14</sup>、-OR<sup>28</sup>、-SR<sup>28</sup>、又は -N(R<sup>29</sup>)(R<sup>30</sup>) を示す。i は 1～3 の何れかの整数を示し、R<sup>14</sup> は水酸基、炭素数 1～4 個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数 1～4 個の N、N-ジアルキルカルバモイル基を示す。R<sup>28</sup> は炭素数 1～8 個のアルキル基又は -A<sup>6</sup>-Q a を示す。R<sup>29</sup> は炭素数 1～8 個のアルキル基、炭素数 1～4 個のアルコキシカルボニル基、又は -A<sup>6</sup>-Q a を示す。R<sup>30</sup> は水素原子又は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示すか、あるいは R<sup>29</sup> と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに 3～6 員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。R z は R x と同義であるか、あるいは -A<sup>5</sup>-R e を示す。R y は水素原子、炭素数 1～8 個のアルキル基又は -A<sup>6</sup>-Q p を示すか、あるいは R z と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数 3～7 個の飽和又は不飽和の含窒素環状置換を形成する。A R は部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環 (a r) を示し、1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の X a で置換されていてもよい。複素環 (a r) は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を 1～4 個含む。X a は炭素数 1～4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、炭素数 3～7 個の環状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>R<sup>14</sup>、-OR<sup>10</sup>、-N(R<sup>11</sup>)(R<sup>12</sup>)、-SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>、又は -COR<sup>27</sup> を示す。R<sup>10</sup> は水素原子、炭素数 1～4 個の低級アルキル基又は -(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>R<sup>14</sup> を示す。R<sup>11</sup> は水素原子又は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示す。R<sup>12</sup> は水



素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、 $-COR^{15}$ 、又は $-SO_2R^{16}$ を示すか、あるいは $R^{11}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。 $R^{15}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基、又は $-A^6-Qa$ を示す。 $R^{13}$ 及び $R^{16}$ はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。 $R^{27}$ は水素原子、水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。

Yは水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、 $-(CH_2)_mN(R^{18})(R^{19})$ 、又は $-C(R^{20})_2OC(O)A^3R^{21}$ を示す。mは整数2又は3を示す。 $R^{18}$ は $R^{19}$ と同じであるか、あるいは $R^{19}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。 $R^{19}$ はメチル基、エチル基、又はプロピル基を示す。 $R^{20}$ は水素原子、メチル基、エチル基、又はプロピル基を示す。 $R^{21}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数3～6個の環状飽和アルキル基、又はフェニル基を示し、 $A^3$ は単結合又は酸素原子を示す。]で表される化合物又はその塩。

#### 【請求項2】

ARがナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ-2H-イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール、1H-ベンゾトリアゾール、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1, 8〕ナフタリジン、〔1, 5〕ナフタリジン、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1, 3-ジヒドロインドール、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール、2H-イソインドール、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン、7H-プリン、又は4H-クロメンの残基（上記残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）である請求項1に記載の化合物又はその塩。

#### 【請求項3】

ARがナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-

5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一

若しくは異なる2個以上のX aで置換されていてもよい)である請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項4】

R sが $-D-R_x$ 又は $-N(R_y)(R_z)$ であり、Dが単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-C(O)-$ であり、 $R_x$ が炭素数3~8個の直鎖状若しくは分枝状の飽和アルキル基であるか、あるいは $R_a$ 、 $R_b$ 、又は $R_c$ であり、 $R_a$ 中のkが0又は1~3の何れかの整数であり、 $R^1$ が炭素数3~7個の飽和シクロアルキル基又は炭素数6~8個の縮合飽和シクロアルキル基であり、 $R^1$ は1個又は同一若しくは異なる2個以上の炭素数1~4の低級アルキル基で置換されていてもよく、 $R_b$ 中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H-クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール基、又はジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール基(上記の基は環上の任意の位置で $A^2$ と結合する)であり、 $A^1$ が単結合又は炭素数1~3個のアルキレン(a)であり、該アルキレン(a)は炭素数1~4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されていてもよく、 $A^2$ は単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ であるときには、 $A^1$ はエチレン又はトリメチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、炭素数1~4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、 $-OR^5$ 、 $-N(R^6)(R^{6'})$ 、 $-NHCOR^7$ 、 $-NH_2SO_2R^8$ 、又は $-A^6-Q_a$ であるか、あるいはそれらが互いに繋がってメチレンジオキシ基を形成し、 $Q_a$ はフェニル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、又はインダゾリル基(上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上の $T^1$ で置換されていてもよく、環上の任意の位置で $A^6$ と結合する)であり、 $R^4$ 及び $R^6$ がそれぞれ独立に水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基であり、 $R^5$ 及び $R^7$ がそれぞれ独立に水素原子、炭素数1~4個の低級アルキル基、又は $-A^6-Q_a$ であり、 $R^8$ が炭素数1~4個の低級アルキル基であり、 $R^{6'}$ は $R^6$ と同義であるか、あるいは $R^6$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3~6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成し、 $R_c$ 中のpが2~4の何れかの整数であり、 $A^4$ が単結合であるか、あるいはメチレン又はエチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $R_d$ が水素原子、炭素数1~8個のアルキル基、又は $Q_a$ であり、 $R_e$ が炭素数1~8個のアルキル基、 $-A^6-Q_a$ 、 $-(CH_2)_iR^{14}$ 、 $-OR^{28}$ 、 $-SR^{28}$ 、又は $-N(R^{29})(R^{30})$ であり、iが1~3の何れかの整数であり、 $R^{14}$ が水酸基、炭素数1~4個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数1~4個のN、N-ジアルキルカルバモイル基であり、 $R^{28}$ が炭素数1~8個のアルキル基又は $-A^6-Q_a$ であり、 $R^{29}$ が炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~4個のアルコキシカルボニル基、又は $-A^6-Q_a$ であり、 $R^{30}$ が水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基であるか、あるいは $R^{29}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3~6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しており、 $R_z$ が $R_x$ と同義であるか、あるいは $-A^5-R_e$ を示し、 $R_y$ が水素原子、炭素数1~8個のアルキ

ル基、又は $-A^6-Q^p$ であるか、あるいは $R_z$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数3～7の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成する請求項1から3のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項5】

$R_s$ が $-O-R_x$ である請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物又はその塩。

【請求項6】

$A^R$ が芳香環(E)上の $C^3$ の位置に結合しており、 $R_s$ が $C^4$ 、 $C^5$ 、又は $C^6$ のうちの何れか1つの環構成炭素原子と結合する請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項7】

$A^R$ が芳香環(E)上の $C^2$ の位置で結合しており、 $R_s$ が $C^3$ 、 $C^4$ 、又は $C^5$ のうちの何れか1つの環構成炭素原子と結合する請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項8】

$R_s$ が $-O-R_x$ であり、芳香環(E)において $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、及び $C^6$ のいずれもVで置き換えられていない請求項6に記載の化合物又はその塩。

【請求項9】

nが整数2であり、Yが水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基である請求項7に記載の化合物又はその塩。

【請求項10】

$R_s$ が芳香環(E)上の $C^5$ 又は $C^6$ のうちの何れか1つの環構成炭素原子と結合する請求項6に記載の化合物又はその塩。

【請求項11】

$R_s$ が $-O-R_x$ であり、芳香環(E)において $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、及び $C^6$ のいずれもVで置き換えられていない請求項10に記載の化合物又はその塩。

【請求項12】

nが整数2であり、Yが水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基である請求項11に記載の化合物又はその塩。

【請求項13】

$R_s$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^6$ がVで置き換えられている請求項6に記載の化合物又はその塩。

【請求項14】

nが整数2であり、Vが $Z_x$ で置換された炭素原子であり、Dが酸素原子であり、Yが水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基である請求項13に記載の化合物又はその塩。

【請求項15】

$R_s$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^5$ が窒素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の炭素原子である請求項6に記載の化合物又はその塩。

【請求項16】

nが整数2であり、 $R_s$ が $-O-R_x$ であり、Yが水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基である請求項15に記載の化合物又はその塩。

【請求項17】

$R_s$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^5$ が $Z_x$ で置換された炭素原子であるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_s$ が $-N(R_y)(R_z)$ である請求項6に記載の化合物又はその塩。

【請求項18】

$R_s$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^5$ が $Z_x$ で置換された炭素原子であるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_s$ が $-D-R_x$ であり、Dが単結合、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-C(O)-$ である請求項6に記載の化合物又はその塩。

【請求項19】

nが整数2であり、 $R_s$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^5$ が $-N(R^{n1})$  (

$R_{n^2}$  で置換された炭素原子であり (ただし  $R_{n^1}$  又は  $R_{n^2}$  のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)、 $C^2$  及び  $C^6$  は無置換の環構成炭素原子であり、 $R_s$  が  $-O-R_x$  であり、 $Y$  が水素原子又は炭素数 1 ~ 4 個の低級アルキル基である請求項 6 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 20】

$n$  が整数 2 であり、 $R_s$  が芳香環 (E) 上の  $C^4$  と結合しており、 $C^5$  が置換基  $Z_x$  で置換された炭素原子であるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^2$  及び  $C^6$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_s$  が  $-O-R_c$  であり、 $Y$  が水素原子又は炭素数 1 ~ 4 個の低級アルキル基である請求項 6 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 21】

請求項 1 から 20 のいずれか 1 項に記載の化合物又は薬理学的に許容されるその塩を有効成分として含む医薬。

【請求項 22】

請求項 1 から 20 のいずれか 1 項に記載の化合物又は薬理学上許容されるその塩を有効成分として含むプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生抑制剤。

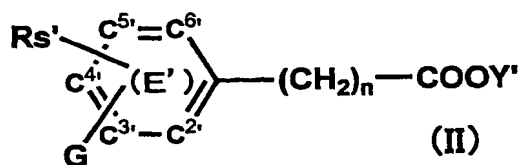
【請求項 23】

プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生により惹起される疾患の予防及び／又は治療のための請求項 21 に記載の医薬。

【請求項 24】

一般式 (I I) :

【化 4】



〔式中、芳香環 (E') 上の  $C^{2'}$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、及び  $C^{6'}$  はそれぞれ独立に環構成炭素原子を示し、 $R_{s'}$  又は  $G$  が結合していない上記環構成炭素原子のうちのいずれか 1 個は  $V'$  で置き換えられていてもよく、 $V'$  は窒素原子を示すか、又は  $Z_{x'}$  で置換された炭素原子を示し、 $Z_{x'}$  は前述の  $Z_x$  と同義であり、ただし  $Z_x$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R_{p^1}$  で保護されていてもよく、 $Z_x$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $R_{p^2}$  で保護されていてもよく、

$R_{s'}$  は  $-D-R_{x'}$  又は  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  を示し、 $-D-R_{x'}$  及び  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  はそれぞれ前述の  $-D-R_x$  及び  $-N(R_y) (R_z)$  と同義であり、ただし  $-D-R_x$  又は  $-N(R_y) (R_z)$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R_{p^1}$  で保護されていてもよく、 $-D-R_x$  又は  $-N(R_y) (R_z)$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $R_{p^2}$  で保護されていてもよく、

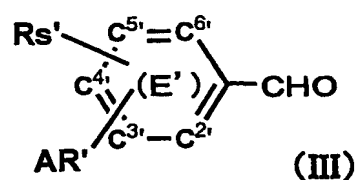
$G$  は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メシラート基、トリフラート基、又は芳香環部分が 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の  $T^1$  で置換されていてもよいアレーンスルホネート基を示し、

$Y'$  は炭素数 1 ~ 4 個の低級アルキル基を示す〕で表される化合物。

【請求項 25】

一般式 (I I I) :

【化 5】



〔式中、芳香環（E'）上のC<sup>2'</sup>、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>、及びC<sup>6'</sup>はそれぞれ独立に環構成炭素原子を示し、Rs'又はGが結合していない上記環構成炭素原子のうちのいずれか1個はV'で置き換えられていてもよく、AR'はARと同義であり、ただしARが水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、ARがアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい〕で表される化合物。

## 【書類名】明細書

## 【発明の名称】置換アリールアルカン酸誘導体及びその用途

## 【技術分野】

## 【0001】

本発明は新規な置換アリールアルカン酸誘導体に関する。さらに詳しく述べれば、医薬として作用を有する置換アリールアルカン酸誘導体及び当該化合物の中間体に関する。

## 【背景技術】

## 【0002】

哺乳動物の生体内では炎症性や物理的などの種々の刺激によって種々のプロスタグランジン及び種々のロイコトリエンが産生される。

プロスタグランジン類及びロイコトリエン類はいずれもアラキドン酸の代謝物質であって脂質メディエーターと呼ばれる生理活性物質であり、各種細胞表面あるいは細胞内に発現する受容体と結合することによって哺乳動物の各種の生理反応を引き起こす。

## 【0003】

アラキドン酸はホスファチジルコリンなどの細胞膜の構成成分であるリン脂質を基質としてホスホリパーゼA<sub>2</sub> (PLA<sub>2</sub>) の酵素活性によって産生される。

PLA<sub>2</sub>により産生されたアラキドン酸は構成型のシクロオキシゲナーゼ(COX)-1あるいは誘導型のCOX-2の酵素活性によりプロスタグランジン(PG)H<sub>2</sub>に変換され、さらに各合成酵素によりPGE<sub>2</sub>、PGD<sub>2</sub>、PGF<sub>2</sub>α、PGI<sub>2</sub>、トロンボキサン(TX)A<sub>2</sub>等に変換される。一方、アラキドン酸は5-リポキシゲナーゼ(5-LO)によっても代謝されてロイコトリエン(LT)A<sub>4</sub>となり、さらにLTA<sub>4</sub>ヒドロラーゼ、LTC<sub>4</sub>シンターゼやグルタチオンSトランスフェラーゼの酵素活性により、LTB<sub>4</sub>、LTC<sub>4</sub>、LTD<sub>4</sub>、LTE<sub>4</sub>等に変換される〔グッドマンギルマン薬理書第9版(廣川書店)、1999年、801頁〕、〔C. D. Funk、サイエンス(SCIENCE)、2001年、294巻、1871頁〕。

## 【0004】

プロスタグランジン類はそれぞれに特異的な受容体と結合し、例えば発熱、血管透過性亢進、血管拡張、腫脹又は痛みなどの炎症反応、気管支平滑筋収縮、血小板凝集、腫瘍細胞増殖、骨吸収促進、神経細胞変性などを引き起こし各種疾患での症状発現あるいは病態形成において重要な役割を担っている。

ロイコトリエン類はそれぞれに特異的な受容体と結合し、例えば白血球の過剰集積又は血管透過性亢進などの炎症反応、平滑筋収縮、粘液分泌、腫瘍細胞増殖などを引き起こす生理活性物質であり、各種疾患での症状発現及び病態形成において重要な役割を担っている。

。

## 【0005】

炎症反応そのものは病原物質や障害に直面したときに生体が生き長らえるために必須の反応であるが、ある状況や疾病においては炎症反応が過度に生じ、あるいは明らかな利益をもたらす理由なしに持続することがある〔グッドマンギルマン薬理書第9版(廣川書店)、1999年、827頁〕。本明細で記述されている急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態とは、急性一過的又は慢性持続的な過度の又は利益をもたらさない炎症反応が生じている状態をいう。また、炎症反応とは、例えば熱等による物理的障害、感染性物質、虚血、抗原-抗体反応などの刺激により引き起こされる一連の出来事であって、よく知られた肉眼的な臨床的兆候として発赤、腫脹、痛覚過敏、発痛を伴うものである。これらの組織学的な機序として血管拡張、血管透過性亢進、白血球及び食細胞の浸潤、組織の分解や線維化が起こることが知られている〔グッドマンギルマン薬理書第9版(廣川書店)、1999年、827頁〕。これらの組織学的な反応の多くはプロスタグランジン及び/又はロイコトリエンによって引き起こされ、プロスタグランジン及び/又はロイコトリエンが炎症反応において重要な役割を担っていることが知られている。

## 【0006】

例えば、自己免疫疾患であり慢性の炎症性疾患の一つである慢性関節リウマチの病態組

組織においてはCOX-2の発現及びPGE<sub>2</sub>やTXA<sub>2</sub>の産生ならびに5-L Oの発現及びLTB<sub>4</sub>の産生が認められ[Bonnetら、プロスタグランジンズ(Prostaglandins)、1995年、50巻、127頁]、また5-L Oの活性化に必要な蛋白であるFLAPを欠損したマウスでは慢性関節リウマチの病態モデルであるコラーゲン誘発関節炎の症状が野生型マウスに比べて軽微であることが報告されており[Griffithsら、ジャーナル・オブ・エクスペリメンタル・メディシン(J. Exp. Med)、1997年、185巻、1123頁]、慢性関節リウマチの病態形成においてプロスタグランジン及びロイコトリエンが重要な役割を担っていることが示されている。

#### 【0007】

慢性アレルギー性疾患の一つである気管支喘息の病態組織においてはPGD<sub>2</sub>及びTXA<sub>2</sub>の産生過剰ならびにLTC<sub>4</sub>及びLTD<sub>4</sub>の産生過剰が認められ[Wenzelら、アメリカン・レビュー・オブ・レスピラトリー・ディゼーズ(Am. Rev. Respir. Dis)、1990年、142巻、112頁]、さらにはPGD<sub>2</sub>受容体欠損マウスでは気管支喘息の病態モデルである気道過敏性反応が起きにくいことが報告され[Matsuokaら、サイエンス(SCIENCE)、2000年、287巻、2013頁]、気管支喘息におけるプロスタグランジン及びロイコトリエンの役割が重要であることが示されている。

#### 【0008】

虚血再灌流後の脳組織においてCOX-2の発現が上昇し、PGE<sub>2</sub>やTXA<sub>2</sub>濃度が増加し、一方で5-L Oの活性が上がり、LTC<sub>4</sub>の産生量が増加し[Ohtsukiら、アメリカン・ジャーナル・オブ・フィジオロジー(Am. J. Physiol.)、1995年、268巻、1249頁]、プロスタグランジン及びロイコトリエンが虚血再灌流障害として認められる梗塞の形成に重要な役割を担っていることが知られている。

#### 【0009】

神経変性を伴う疾患の一つであるアルツハイマー病の病態組織において、COX活性及び5-L O活性が上昇し、またプロスタグランジン及びロイコトリエンがアルツハイマー病の病因物質の一つであるβアミロイド蛋白の形成を引き起こすとともに、さらに神経細胞の変性を引き起こすことが示され[Sugayaら、ジャパニーズ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー(Jpn. J. Pharmacol.)、2000年、82巻、85頁]、プロスタグランジン及びロイコトリエンがアルツハイマー病などの神経変性性疾患の形成に重要な役割を担っていると考えられている。

#### 【0010】

また、例えば、大腸がんの病態組織において、COX及び5-L Oが発現し、またプロスタグランジン及びロイコトリエンの産生量が増加しており[Dreylingら、バイオキミカ・バイオフィジカ・アクタ(Biochim. Biophys. Acta)、1986年、878巻、184頁]、さらにロイコトリエンが大腸がん細胞の増殖を引き起こすことが報告されている[Qiaoら、バイオキミカ・バイオフィジカ・アクタ(Biochim. Biophys. Acta)、1995年、1258巻、215頁]、[Hongら、キャンサー・リサーチ(Cancer Res.)、1999年、59巻:2223頁]。大腸がんの組織においてもプロスタグランジン及びロイコトリエンが重要な役割を担っていると考えられている。

#### 【0011】

プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの疾患、病態への関与は上記に例示した疾患にとどまらず、急性又は慢性の炎症反応が認められる様々な状態、各種の疾患あるいは各種の病態にプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンが関与し、それらが重要な役割を担っていることが示されている。

#### 【0012】

このことから、各種のプロスタグランジン産生抑制剤又はロイコトリエン産生抑制剤が急性又は慢性の炎症反応が認められる状態、各種疾患あるいは病態の予防剤又は治療剤として用いられている。プロスタグランジンの産生抑制作用を持つ医薬として各種の非ステ



ロイド性抗炎症剤 (NSAIDS) があり、慢性関節リウマチや変形性関節炎の治療剤、外傷などに対する消炎鎮痛剤、脳梗塞又は心筋梗塞の予防剤あるいは大腸ポリポージスの予防剤などとして使われている。しかし、各種のNSAIDSはプロスタグランジンの産生のみを抑制する結果、ロイコトリエンの産生量を増加させ、喘息発作、胃腸障害などの副作用を引き起こし、加えて腎障害などの副作用を発揮する。またこれらのNSAIDSでは効果を発揮する用量と副作用を発揮する用量との差が小さく、治療効果の点でも満足 of いくものはない。ロイコトリエンの産生抑制作用を持つ医薬として欧州特許第 279263 号明細書に記載されている 5-LI 阻害剤があり喘息の予防剤として知られているが、肝障害などの副作用を発現させることから投与量が制限され治療効果の点で満足 of いくものではない。ステロイド剤はプロスタグランジンとロイコトリエンの両者の産生を抑制することから各種の急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態、各種疾患あるいは病態に対して予防剤又は治療剤として使われているが、その作用は脂質メディエーターの産生抑制作用にとどまらず、免疫抑制作用による感染症の誘発及び憎悪、正常細胞増殖抑制作用による成長遅延、皮膚萎縮あるいは消化性潰瘍などの強い副作用を持つためにその使用は制限されたものになっている。

#### 【0013】

また、以上のことから、プロスタグランジンとロイコトリエンの両者の産生を抑制し、副作用が少ない化合物は哺乳動物における上記のような生体の状態、疾患又は病態に対する治療剤又は予防剤として有効であると考えられ、またこのような化合物と既存の医薬品とを併用する方法はさらに有効な治療方法又は予防方法であると考えられることから、プロスタグランジンとロイコトリエンの両者の産生を抑制する化合物の開発とその医薬品化が熱望されている。

#### 【0014】

本発明に構造が類似する化合物としては、例えば、WO99/19291 にビフェニル-5-アルカン酸誘導体及びその用途が報告されているが、本発明化合物の一般式 (I) 中の AR に対比する部分がフェニル基であり構造上の特徴が異なる。また、米国特許第 5391817 号明細書 (特開平 7-22399 号公報) にはビアリールホスホリパーゼ A<sub>2</sub> 阻害剤が記載されているが、本発明化合物の一般式 (I) 中の AR に対比する部分がフェニル基のみであり構造上の特徴が異なる。WO00/35886 にはプロテアーゼ阻害剤として二環式複素環化合物が報告されているが、本発明化合物の一般式 (I) 中の AR 上の置換基に対比する部分が異なり、さらに、当該特許明細書に開示された化合物がプロスタグランジン産生抑制作用またはロイコトリエン産生抑制作用を有するか否かについて何ら言及もなされていない。

：【特許文献 1】WO99/19291

【特許文献 2】米国特許第 5391817 号

【特許文献 3】WO00/35886

#### 【発明の開示】

#### 【発明が解決しようとする課題】

#### 【0015】

本発明は、優れたプロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有する新規な化合物を提供することを課題とする。また、本発明は、脂質メディエーターに起因する哺乳動物における各種の炎症性疾患、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患、疼痛、線維症を予防及び/又は治療する化合物を提供することを課題とする。さらに、本発明は、該化合物を含有する医薬組成物を提供することを課題とする。また、本発明は、該化合物を製造するための中間体を提供することを課題とする。これらの課題および他の課題および利点は、当業者にとって以下に示す記載から明らかであろう。

#### 【課題を解決するための手段】

#### 【0016】

前記課題を解決するために、本発明者らは鋭意研究した結果、新規化合物である後記一般式で示される置換アリールアルカン酸誘導体が優れたプロスタグランジン産生抑制作用

及びロイコトリエン産生抑制作用を有することを見出し、本発明を完成したものである。

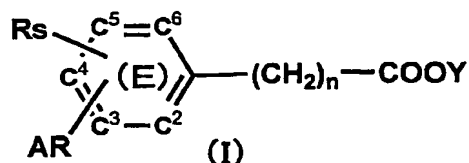
【0017】

すなわち、本発明は、例えば下記(1)～(191)に示すものである。

(1) 一般式(I)：

【0018】

【化1】



[式中、nは1～3の何れかの整数を示す。

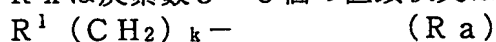
芳香環(E)上のC<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、及びC<sup>6</sup>はそれぞれ独立に環構成炭素原子を示す。Rs又はARが結合していない環構成炭素原子のうちのいずれか1個はVで置き換えられていてもよい。

Vは窒素原子を示すか、あるいはZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子を示す。Z<sub>x</sub>は、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、-OR<sup>9</sup>、又は-N(R<sup>n1</sup>)(R<sup>n2</sup>)を示す。R<sup>9</sup>は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は-A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub>を示す。ただしA<sup>6</sup>は単結合又はメチレンを示し、Q<sub>p</sub>はフェニル基を示し、該フェニル基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のT<sup>1</sup>で置換されていてもよい。T<sup>1</sup>は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。R<sup>n1</sup>は水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基を示し、R<sup>n2</sup>はR<sup>n1</sup>と同義であるか、あるいは-COR<sup>23</sup>若しくは-SO<sub>2</sub>R<sup>24</sup>を示すか、又はR<sup>n1</sup>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。R<sup>23</sup>は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数1～4個の低級アルコキシ基、-O-A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub>、又は-N(R<sup>25</sup>)(R<sup>26</sup>)を示す。R<sup>25</sup>は水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基を示す。R<sup>26</sup>はR<sup>25</sup>と同義であるか、あるいはR<sup>25</sup>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。R<sup>24</sup>は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。

Rsは-D-R<sub>x</sub>又は-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)を示す。

Dは単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-を示す。

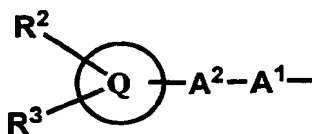
R<sub>x</sub>は炭素数3～8個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基を示すか、あるいは次式：



で表されるRa、次式：

【0019】

【化2】

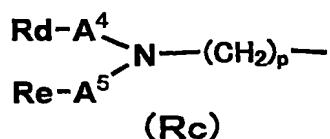


(Rb)

で表されるRb、又は次式：

【0020】

## 【化3】



で表される R c を示す。R a 中の k は 0 又は 1～3 の何れかの整数を示す。R<sup>1</sup> は炭素数 3～7 個の環状飽和アルキル基又は炭素数 6～8 個の縮合環式飽和アルキル基を示し、R<sup>1</sup> は 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の炭素数 1～4 の低級アルキル基で置換されていてもよい。R b 中の Q は部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環 (q) を示し、環上の任意の位置で A<sup>2</sup> と結合する。複素環 (q) は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を 1～4 個含む。A<sup>1</sup> は単結合又は炭素数 1～3 個のアルキレン (a) を示し、アルキレン (a) は炭素数 1～4 個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されていてもよい。A<sup>2</sup> は単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は -N(R<sup>4</sup>)- を示す (ただし A<sup>2</sup> が酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>- 又は -N(R<sup>4</sup>)- を示すときには、A<sup>1</sup> はエチレン又はトリメチレンを示す)。R<sup>2</sup> 及び R<sup>3</sup> はそれぞれ独立に水素原子、炭素数 1～4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、-OR<sup>5</sup>、-N(R<sup>6</sup>)(R<sup>6'</sup>)、-NHCOR<sup>7</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、又は -A<sup>6</sup>-Q a を示すか、あるいはそれらが互いに繋がってメチレンジオキシ基を示す。Q a は部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環 (q a) を示し、環上の任意の位置で A<sup>6</sup> と結合し、1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されていてもよい。複素環 (q a) は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を 1～4 個含む。R<sup>4</sup> 及び R<sup>6</sup> はそれぞれ独立に水素原子又は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示す。R<sup>5</sup> 及び R<sup>7</sup> はそれぞれ独立に水素原子、炭素数 1～4 個の低級アルキル基、又は -A<sup>6</sup>-Q a を示す。R<sup>8</sup> は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示す。R<sup>6'</sup> は R<sup>6</sup> と同義であるか、あるいは R<sup>6</sup> と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに 3～6 員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。R c 中の p は 2～4 の何れかの整数を示す。A<sup>4</sup> は単結合、メチレン、又はエチレンを示す。A<sup>5</sup> は -C(O)-、-C(S)-、又は -S(O)<sub>2</sub>- を示す。R d は水素原子、炭素数 1～8 個のアルキル基、又は Q a を示す。R e は炭素数 1～8 個のアルキル基、-A<sup>6</sup>-Q a、-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>R<sup>14</sup>、-OR<sup>28</sup>、-SR<sup>28</sup>、又は -N(R<sup>29</sup>)(R<sup>30</sup>) を示す。i は 1～3 の何れかの整数を示し、R<sup>14</sup> は水酸基、炭素数 1～4 個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数 1～4 個の N、N-ジアルキルカルバモイル基を示す。R<sup>28</sup> は炭素数 1～8 個のアルキル基又は -A<sup>6</sup>-Q a を示す。R<sup>29</sup> は炭素数 1～8 個のアルキル基、炭素数 1～4 個のアルコキシカルボニル基、又は -A<sup>6</sup>-Q a を示す。R<sup>30</sup> は水素原子又は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示すか、あるいは R<sup>29</sup> と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに 3～6 員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。R z は R x と同義であるか、あるいは -A<sup>5</sup>-R e を示す。R y は水素原子、炭素数 1～8 個のアルキル基又は -A<sup>6</sup>-Q p を示すか、あるいは R z と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数 3～7 個の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成する。A R は部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環 (a r) を示し、1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の X a で置換されていてもよい。複素環 (a r) は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を 1～4 個含む。X a は炭素数 1～4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、炭素数 3～7 個の環状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、-(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>R<sup>14</sup>、-OR<sup>10</sup>、-N(R<sup>11</sup>)(R<sup>12</sup>)、-SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>、又は -COR<sup>27</sup> を示す。R<sup>10</sup> は水素原子、炭素数 1～4 個の低級アルキル基又は -(CH<sub>2</sub>)<sub>i</sub>R<sup>14</sup> を示す。R<sup>11</sup> は水素原子又は炭素数 1～4 個の低級アルキル基を示す。R<sup>12</sup> は水

素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、 $-\text{COR}^{15}$ 、又は $-\text{SO}_2\text{R}^{16}$ を示すか、あるいは $\text{R}^{11}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。 $\text{R}^{15}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基、又は $-\text{A}^6-\text{Qa}$ を示す。 $\text{R}^{13}$ 及び $\text{R}^{16}$ はそれぞれ独立に炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。 $\text{R}^{27}$ は水素原子、水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を示す。

$\text{Y}$ は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、 $-(\text{CH}_2)_m\text{N}(\text{R}^{18})(\text{R}^{19})$ 、又は $-\text{C}(\text{R}^{20})_2\text{OC}(\text{O})\text{A}^3\text{R}^{21}$ を示す。 $m$ は整数2又は3を示す。 $\text{R}^{18}$ は $\text{R}^{19}$ と同じであるか、あるいは $\text{R}^{19}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。 $\text{R}^{19}$ はメチル基、エチル基、又はプロピル基を示す。 $\text{R}^{20}$ は水素原子、メチル基、エチル基、又はプロピル基を示す。 $\text{R}^{21}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数3～6個の環状飽和アルキル基、又はフェニル基を示し、 $\text{A}^3$ は単結合又は酸素原子を示す。]で表される化合物〔以下、単に「本発明化合物(I)」と称することがある〕又はその塩。

#### 【0021】

(2) 一般式(I)において、 $\text{AR}$ が芳香環(E)上の $\text{C}^2$ 又は $\text{C}^3$ の何れかの原子と結合した上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0022】

(3) 一般式(I)において、 $n$ が整数2である上記(1)又は(2)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

#### 【0023】

(4) 一般式(I)において、 $\text{AR}$ がナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ[d]イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ[c]イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ-2H-イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール、1H-ベンゾトリアゾール、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール、フタラジン、[1, 8]ナフタリジン、[1, 5]ナフタリジン、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン、チエノ[3, 2-c]ピリジン、チエノ[3, 2-b]ピリジン、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール、ベンゾ[d]イソオキサゾール、ベンゾ[c]イソオキサゾール、インドリジン、1, 3-ジヒドロインドール、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール、2H-イソインドール、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン、7H-プリン、又は4H-クロメンの残基(上記の残基は1個又は同一もしくは異なる2個以上の $\text{Xa}$ で置換されていてもよい)である上記(1)から(3)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

#### 【0024】

(5) 一般式(I)において、 $\text{AR}$ がナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル

基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル

基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい）である上記（1）から（3）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0025】

（6）一般式（I）において、ARがナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ[d]イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ[c]イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン、イソキノリン、又はジヒドロ-2H-イソキノリンの残基（上記の残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい）である上記（1）から（3）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0026】

（7）一般式（I）において、ARがシンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール、1H-ベンゾトリアゾール、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール、フタラジン、[1, 8]ナフタリジン、[1, 5]ナフタリジン、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン、チエノ[3, 2-c]ピリジン、チエノ[3, 2-b]ピリジン、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール、ベンゾ[d]イソオキサゾール、ベンゾ[c]イソオキサゾール、インドリジン、1, 3-ジヒドロインドール、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール、2H-イソインドール、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン、7H-プリン、又は4H-クロメンの残基（上記の残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>を有していてもよい）である上記（1）から（3）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0027】

（8）一般式（I）において、R<sub>s</sub>が-D-R<sub>x</sub>又は-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)であり、Dが単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-であり、R<sub>x</sub>が炭素数3～8個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基を示すか、あるいはR<sub>a</sub>、R<sub>b</sub>、又はR<sub>c</sub>であり、R<sub>a</sub>中のkが0又は1～3の何れかの整数であり、R<sup>1</sup>が炭素数3～7個の環状飽和アルキル基又は炭素数6～8個の縮合環式飽和アルキル基であり、R<sup>1</sup>は1個又は同一若しくは異なる2個以上の炭素数1～4の低級アルキル基で置換されてもよく、R<sub>b</sub>中のQがフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H-クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール

ル基、又はジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール基（上記の基は環上の任意の位置で $A^2$ と結合する）であり、 $A^1$ が単結合又は炭素数1～3個のアルキレン（a）であり、アルキレン（a）は炭素数1～4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されてもよく、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ であり（ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ を示すときには、 $A^1$ はエチレン又はトリメチレンを示す）、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、 $-OR^5$ 、 $-N(R^6)(R^{6'})$ 、 $-NHCO R^7$ 、 $-NH SO_2 R^8$ 、又は $-A^6-Q a$ であるか、それらが繋がってメチレンジオキシ基を示し、 $Q a$ がフェニル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、又はインダゾリル基（これらの基は1個又は同一若しくは異なる2個以上の $T^1$ で置換されていてもよく、環上の任意の位置で $A^6$ と結合する）であり、 $R^4$ 及び $R^6$ がそれぞれ独立に水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基であり、 $R^5$ 及び $R^7$ がそれぞれ独立に水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は $-A^6-Q a$ であり、 $R^8$ が炭素数1～4個の低級アルキル基であり、 $R^{6'}$ は $R^6$ と同義であるか、あるいは $R^6$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しており、 $R c$ 中の $p$ が2～4の何れかの整数であり、 $A^4$ が単結合あるいはメチレン又はエチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $R d$ が水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は $Q a$ であり、 $R e$ が炭素数1～8個のアルキル基、 $-A^6-Q a$ 、 $-(CH_2)_i R^{14}$ 、 $-OR^{28}$ 、 $-SR^{28}$ 、又は $-N(R^{29})(R^{30})$ であり、 $i$ が1～3の何れかの整数であり、 $R^{14}$ が水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数1～4個の $N$ 、 $N$ -ジアルキルカルバモイル基であり、 $R^{28}$ が炭素数1～8個のアルキル基又は $-A^6-Q a$ であり、 $R^{29}$ が炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基、又は $-A^6-Q a$ 基であり、 $R^{30}$ が水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基であるか、あるいは $R^{29}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成し、 $R z$ が $R x$ と同義であるか、あるいは $-A^5-R e$ であり、 $R y$ が水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は $-A^6-Q p$ であるか、あるいは $R z$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数3～7の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成する上記（1）から（7）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0028】

（9）一般式（I）において、芳香環（E）上の $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、又は $C^6$ のうち、 $R s$ 又は $A R$ が結合していない何れか一つの環構成炭素原子が窒素原子で置き換えられている上記（1）から（8）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0029】

（10）一般式（I）において、芳香環（E）上の $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、又は $C^6$ のうち、 $R s$ 又は $A R$ が結合していない何れか一つの環構成炭素原子が $-N(R^{n1})(R^{n2})$ で置換されている（ただし $R^{n1}$ 又は $R^{n2}$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す）上記（1）から（8）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0030】

（11）一般式（I）において、 $R s$ が $-O-R x$ である上記（1）又は（10）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0031】

（12）一般式（I）において、 $R s$ が $-O-R c$ である上記（1）から（11）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0032】

(13) 一般式 (I) において、 $R_s$  が  $-N(R_y)(R_z)$  である上記 (1) から (10) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0033】

(14) 一般式 (I) において、 $R_s$  が  $-D-R_x$  であり、 $D$  が単結合、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は  $-C(O)-$  の何れかである上記 (1) から (10) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0034】

(15) 一般式 (I) において、 $R_s$  が  $-S-R_x$  である上記 (1) から (10) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0035】

(16) 一般式 (I) において、 $AR$  が芳香環 (E) 上の  $C^2$  の位置で結合し、 $R_s$  が  $C^3$ 、 $C^4$ 、又は  $C^5$  のうちの何れか一つの環構成炭素原子と結合する上記 (1) に記載の化合物又はその塩。

## 【0036】

(17) 一般式 (I) において、 $R_s$  が  $-O-R_x$  であり、芳香環 (E) 上の環構成炭素原子が  $V$  で置き換えられていない上記 (16) に記載の化合物又はその塩。

## 【0037】

(18) 一般式 (I) において、 $n$  が整数 2 であり、 $Y$  が水素原子又は炭素数 1~4 個の低級アルキル基である上記 (16) 又は (17) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0038】

(19) 一般式 (I) において、 $n$  が整数 2 であり、 $AR$  が芳香環 (E) 上の  $C^2$  の位置で結合しており、 $R_s$  が  $C^3$ 、 $C^4$  又は  $C^5$  のうちの何れか一つの環構成炭素原子と結合しており、 $R_s$  が  $-O-R_x$  であり、 $Y$  が水素原子又は炭素数 1~4 個の低級アルキル基であり、芳香環 (E) において  $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、及び  $C^6$  はいずれも  $V$  で置き換えられていない上記 (4) に記載の化合物又はその塩。

## 【0039】

(20) 一般式 (I) において、 $n$  が整数 2 であり、 $AR$  が芳香環 (E) 上の  $C^2$  の位置で結合しており、 $R_s$  が  $C^3$ 、 $C^4$ 、又は  $C^5$  のうちの何れか一つの環構成炭素原子と結合しており、 $R_s$  が  $-O-R_x$  であり、 $Y$  が水素原子又は炭素数 1~4 個の低級アルキル基であり、芳香環 (E) において  $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、及び  $C^6$  はいずれも  $V$  で置き換えられていない上記 (5) に記載の化合物又はその塩。

## 【0040】

(21) 一般式 (I) において、 $AR$  上に置換されていてもよい  $X_a$  がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシル基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイル基である上記 (16) から (20) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0041】

(22) 一般式 (I) において、 $R_s$  が  $-O-R_x$  であり、 $R_x$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘブチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基であるか、あるいは  $R_b$  であり (ただし、 $R_b$  中の  $Q$  はフェニル基又はインダン-2-イル基である)、 $A^1$  が単結合であるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基であるか、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、 $A^2$  が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  であり (ただし  $A^2$  が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  を示すときには、 $A^1$  はエチレンを示す)、 $R^2$  及び  $R^3$  はそれぞれ独立に水素原子、メチ



ル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基（ただしQがフェニル基であり、 $A^1$ が単結合であるか又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である）である上記（16）から（21）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0042】

（23） 一般式（I）において、 $R_x-D-$ が芳香環（E）上の $C^3$ の位置で結合する上記（16）から（22）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0043】

（24） 一般式（I）において、 $R_x-D-$ が芳香環（E）上の $C^4$ の位置で結合する上記（16）から（22）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0044】

（25） 一般式（I）において、 $R_x-D-$ が芳香環（E）上の $C^5$ の位置で結合する上記（16）から（22）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0045】

（26） 一般式（I）において、 $n$ が1～3の何れかの整数であり、 $AR$ が $C^2$ に結合しており、 $Rs$ が $C^3$ 、 $C^4$ 、又は $C^5$ の何れか1個の環構成炭素原子に結合しており、 $C^3$ 、 $C^4$ 、又は $C^5$ のうち $Rs$ が結合していない環構成炭素原子はVで置き換えられていてもよく、

Vが窒素原子あるいは $Z_x$ で置換された炭素原子であり、 $Z_x$ がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N、N-ジメチルアミノ基、N、N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN、N-ジメチルスルファモイルアミノ基であり、

$Rs$ が $-D-R_x$ 又は $-N(R_y)(R_z)$ であり、Dが酸素原子又はイオウ原子であり、 $R_x$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいは $R_b$ 又は $R_c$ であり、 $R_b$ 中のQがフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ （メチル）-、又は $-N$ （エチル）-であり（ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ （メチル）-、又は $-N$ （エチル）-を示すとき $A^1$ はエチレンを示す）。 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり（ただしQがフェニル基であり、 $A^1$ が単結合を示すか又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である）。 $R_c$ 中のpが整数2又は3であり、 $A^4$ が単結合又はメチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $R_d$ が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $R_e$ がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル

ル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、*N*-メチルアミノ基、*N*, *N*-ジメチルアミノ基、*N*-エチルアミノ基、*N*, *N*-ジエチルアミノ基、*N*-プロピルアミノ基、*N*-イソプロピルアミノ基、*N*-ブチルアミノ基、*N*-イソブチルアミノ基、*N*-*t*-ブチルアミノ基、*N*-シクロプロピルアミノ基、*N*-シクロペンチルアミノ基、*N*-シクロヘキシルアミノ基、*N*-フェニルアミノ基、*N*-(4-メチルフェニル)アミノ基、*N*-(4-クロロフェニル)アミノ基、*N*-(4-フルオロフェニル)アミノ基、*N*-(ピリジン-2-イル)アミノ基、*N*-(ピリジン-3-イル)アミノ基、*N*-(ピリジン-4-イル)アミノ基、*N*-(フラン-2-イル)アミノ基、*N*-(フラン-3-イル)アミノ基、*N*-(チオフェン-2-イル)アミノ基、*N*-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基であり、

*R*<sub>2</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(*N*, *N*-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェ

ニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基であり、R<sub>y</sub>が水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基を形成しており、

A Rがナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-

6-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）であり、Xaがオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、

カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、Yが水素原子、メチル基又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0046】

(27) 一般式(I)において、nが整数2であり、

$C^2$ がARで結合された炭素原子であり、 $C^3$ がRsで結合された炭素原子であり、 $C^4$ がVで置き換えられていてもよく、 $C^5$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、

Vが窒素原子であるか、あるいはZxで置換された炭素原子であり、Zxがフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基であり、

Rsが-O-Rxであり、Rxがブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、

チル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、

ARがナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0047】

(28) 一般式(I)において、nが整数2であり、

C<sup>2</sup>がARで結合された炭素原子であり、C<sup>4</sup>がR<sub>s</sub>で結合された炭素原子であり、C<sup>5</sup>はVで置き換えられていてもよく、C<sup>3</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示し、

Vが窒素原子であるか、あるいはZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、Z<sub>x</sub>がフッ素原子、

メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基であり、

R<sub>s</sub>が-O-R<sub>x</sub>であり、R<sub>x</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、

ARがナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール

ー5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0048】

(29) 一般式(I)において、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>5</sup>又はC<sup>6</sup>のうちの何れかの原子と結合する上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0049】

(30) 一般式(I)において、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、芳香環(E)においてC<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、及びC<sup>6</sup>はいずれもVで置き換えられていない上記(29)に記載の化合物又はその塩。

【0050】

(31) 一般式(I)において、nが整数2であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(29)又は(30)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0051】

(32) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>5</sup>又はC<sup>6</sup>のうちの何れかの環構成炭素原子と結合しており、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基であり、芳香環(E)においてC<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、及びC<sup>6</sup>はいずれもVで置き換えられていない上記(4)に記載の化合物又はその塩。



【 0 0 5 2 】

(33) 一般式(I)において、 $n$ が整数2であり、 $AR$ が芳香環(E)上の $C^3$ に結合しており、 $Rs$ が芳香環(E)上の $C^5$ 又は $C^6$ のうちの何れかの環構成炭素原子と結合しており、 $Rs$ が $-O-R_x$ であり、 $Y$ が水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基であり、芳香環(E)において $C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 、及び $C^6$ はいずれも $V$ で置き換えられていない上記(5)に記載の化合物又はその塩。

【 0 0 5 3 】

(34) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいXaがメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN,N-ジメチルスルファモイル基である上記(29)から(33)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【 0 0 5 4 】

(35) 一般式(I)において、 $R_s$ が $-O-R_x$ であり、 $R_x$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基であるか、あるいは $R_b$ であり(ただし、 $R_b$ 中の $Q$ がフェニル基又はインダン-2-イル基である)、 $A^1$ は単結合であるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であるときには、 $A^1$ はエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基(ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)である上記(29)から(34)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0055】

(36) 一般式 (I) において、R<sub>s</sub>が芳香環 (E) 上のC<sup>5</sup>の位置で結合する上記 (29) から (35) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【 0 0 5 6 】

(37) 一般式 (I) において、R<sub>s</sub>が芳香環 (E) 上の C<sup>6</sup> の位置で結合する上記 (29) から (35) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0057】

[illegible]

ニル) エチル基、1-(4-フルオロフェニル) エチル基、1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、1-(4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2,3-ジメチルフェニルメチル基、3,5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2,3-ジフルオロフェニルメチル基、2,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,5-ジフルオロフェニルメチル基、3,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,3-ジクロロフェニルメチル基、2,4-ジクロロフェニルメチル基、2,5-ジクロロフェニルメチル基、2,6-ジクロロフェニルメチル基、3,4-ジクロロフェニルメチル基、3,5-ジクロロフェニルメチル基、3,6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、2-(4-メチルフェニル) エチル基、2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N,N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基であり、

ARが、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-

2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0058】

(39) 一般式(I)において、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、R<sub>s</sub>が芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>6</sup>がVで置き換えられている上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0059】

(40) 一般式(I)において、nが整数2であり、VがZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、R<sub>s</sub>が-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(39)に記載の化合物又はその塩。

【0060】

(41) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、R<sub>s</sub>が芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>6</sup>がZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、R<sub>s</sub>が-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(4)に記載の化合物又はその塩。

【0061】

(42) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、R<sub>s</sub>が芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>6</sup>がZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、R<sub>s</sub>が-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(5)に記載の化合物又はその塩。

【0062】

(43) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいX<sub>a</sub>がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN, N-ジメチルスルファモイル基である上記(39)から(42)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0063】

(44) 一般式(I)において、R<sub>s</sub>が-O-R<sub>x</sub>であり、R<sub>x</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基であるか、あるいはR<sub>b</sub>であり(ただし、R<sub>b</sub>中のQがフェニル基又はインダン-2-イル基である)、A<sup>1</sup>が単結合であるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、A<sup>2</sup>が単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-であり(

ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ （メチル） $-$ 、又は $-N$ （エチル） $-$ であるときには、 $A^1$ はエチレンである）、 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基（ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である）である上記（39）から（43）のいずれかに記載の化合物又はその塩。

#### 【0064】

（45）一般式（I）において、 $n$ が整数2であり、

$C^3$ が $AR$ で結合された炭素原子であり、 $C^4$ が $Rs$ で結合された炭素原子であり、 $C^6$ が $Zx$ で置換された炭素原子であり、 $C^2$ 及び $C^5$ が無置換の環構成炭素原子であり、

$Zx$ がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基であり、

$Rs$ が $-O-Rx$ であり、 $Rx$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-（2-フルオロフェニル）エチル基、1-（3-フルオロフェニル）エチル基、1-（4-フルオロフェニル）エチル基、1-（2-クロロフェニル）エチル基、1-（3-クロロフェニル）エチル基、1-（4-クロロフェニル）エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、3-（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、4-（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、2-（2-メチルフェニル）エチル基、2-（3-メチルフェニル）エチル基、2-（4-メチルフェニル）エチル基、2-（2-メトキシフェニル）エチル基、2-（3-メトキシフェニル）エチル基、2-（4-メトキシフェニル）エチル基、2-（2-フルオロフェニル）エチル基、2-（3-フルオロフェニル）エチル基、2-（4-フルオロフェニル）エチル基、2-（2-クロロフェニル）エチル基、2-（3-クロロフェニル）エチル基、2-（4-クロロフェニル）エチル基、2-〔2-（トリフルオロメチル）フェニル〕エチル基、2-〔3-（トリフルオロメチル）フェニル〕エチル基、2-〔4-（トリフルオロメチル）フェニル〕エチル基、2-〔4-（ $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ）フェニル〕エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-（2-クロロフェニルオキシ）エチル基、2-（3-クロロフェニルオキシ）エチル基、2-（4-クロロフェニルオキシ）エチル基、2-（フェニルチオ）エチル基、2-（ $N$ -フェニル- $N$ -メチルアミノ）エチル基、又は2-（ $N$ -エチル- $N$ -フェニルアミノ）エチル基であり、

ARが、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0065】

(46) 一般式(I)において、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsは芳香環(E)上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>が窒素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0066】

(47) 一般式(I)において、nが整数2であり、Dが酸素原子であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(46)に記載の化合物又はその塩。

。

## 【0067】

(48) 一般式(I)において、 $n$ が整数2であり、 $AR$ が芳香環(E)上の $C^3$ に結合しており、 $Rs$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^5$ が窒素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs$ が $-O-R_x$ であり、 $Y$ が水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(4)に記載の化合物又はその塩。

## 【0068】

(49) 一般式(I)において、 $n$ が整数2であり、 $AR$ が芳香環(E)上の $C^3$ に結合しており、 $Rs$ が芳香環(E)上の $C^4$ と結合しており、 $C^5$ が窒素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs$ が $-O-R_x$ であり、 $Y$ が水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(5)に記載の化合物又はその塩。

## 【0069】

(50) 一般式(I)において、 $AR$ 上に置換していてもよい $X_a$ がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシル基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイル基である上記(46)から(49)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0070】

(51) 一般式(I)において、 $Rs$ が $-O-R_x$ であり、 $R_x$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基であるか、あるいは $R_b$ であり(ただし、 $R_b$ 中の $Q$ がフェニル基又はインダン-2-イル基である)、 $A^1$ が単結合であるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-又は $-N$ (エチル)-であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であるときには、 $A^1$ がエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基(ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときは、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)である上記(46)から(50)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

## 【0071】

(52) 一般式(I)において、 $n$ が整数2であり、 $C^3$ が $AR$ で結合された炭素原子であり、 $C^4$ が $Rs$ で結合された炭素原子であり、 $C^5$ が窒素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs$ が $-O-R_x$ であり、 $R_x$ が、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基

A Rが、ナフタレンー2-イル基、6-ヒドロキシナフタレンー2-イル基、6-メトキシナフタレンー2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレンー2-イル基、6-アミノナフタレンー2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレンー2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレンー2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレンー2-イル基、ベンゾ〔b〕フランー5-イル基、2-メチルベンゾ〔b〕フランー5-イル基、3-メチルベンゾ〔b〕フランー5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ〔b〕フランー5-イル基、ベンゾ〔b〕チオフエンー5-イル基、2-メチルベンゾ〔b〕チオフエンー5-イル基、3-メチルベンゾ〔b〕チオフエンー5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ〔b〕チオフエンー5-イル基、1H-インドールー5-イル基、2-メチルー1H-インドールー5-イル基、3-メチルー1H-インドールー5-イル基、2,3-ジメチルー1H-インドールー5-イル基、1-メチルー1H-インドールー5-イル基、1,2-ジメチルー1H-インドールー5-イル基、1,3-ジメチルー1H-インドールー5-イル基、1,2,3-トリメチルー1H-インドールー5-イル基、1-エチルー1H-インドールー5-イル基、1-エチルー2-メチルー1H-インドールー5-イル基、1-エチルー3-メチルー1H-インドールー5-イル基、1-エチルー2,3-ジメチルー1H-インドールー5-イル基、1-プロピルー1H-インドールー5-イル基、2-メチルー1-プロピルー1H-インドールー5-イル基、3-メチルー1-プロピルー1H-インドールー5-イル基、2,3-ジメチルー1-プロピルー1H-インドールー5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドールー5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチルー1H-インドールー5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチルー1H-インドールー5-イル基、2,3-ジメチルー1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドールー5-イル基、ベンゾチアゾールー6-イル基、2-メチルベンゾチアゾールー6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾールー6-イル基、2-アミノベンゾチアゾールー6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾールー6-イル基、2-オキソ-3-メチルー2,3-ジヒドロベンゾチアゾールー6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾールー6-イル基、2-チオキソ-3-メチルー2,3-ジヒドロベンゾチアゾールー6-イル基、

ール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0072】

(53) 一般式(I)において、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>がZ<sub>x</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-D-R<sub>x</sub>であり、Dは単結合、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0073】

(54) 一般式(I)において、nが整数2であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(53)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0074】

(55) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>がZ<sub>x</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-D-R<sub>x</sub>であり、Dが単結合、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(4)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0075】

(56) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>がZ<sub>x</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-D-R<sub>x</sub>であり、Dが単結合、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(5)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0076】

(57) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいX<sub>a</sub>がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN, N-ジメチルスルファモイル基である上記(53)から(56)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

#### 【0077】

(58) 一般式(I)において、Rsが-D-R<sub>x</sub>であり、R<sub>x</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基であるか、あるいはR<sub>b</sub>であり(ただし、R<sub>b</sub>中のQがフェニル基又はインダン-2-イル基である)、A<sup>1</sup>が単結合で



あるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、 $A^2$ は単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は $-N$  (エチル)  $-$ であり (ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 又は $-N$  (エチル)  $-$ を示すときには、 $A^1$ はエチレンを示す)、 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基 (ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合であるか又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときは、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である) である上記 (53) から (57) のいずれかに記載の化合物又はその塩。

# 【0078】

(59) 一般式 (I) において、 $n$ が1~3の何れかの整数であり、 $C^3$ が $AR$ で結合された炭素原子であり、 $C^4$ が $Rs$ で結合された炭素原子であり、 $C^5$ が $V$ で置き換えられてもよく、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $V$ が窒素原子であるか、又は $Zx$ で置換された炭素原子であり、 $Zx$ がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基であり、 $Rs$ が $-S-Rx$ であり、 $Rx$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいは $Rb$ 又は $Rc$ であり、 $Rb$ 中の $Q$ がフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は $-N$  (エチル)  $-$ であり (ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、 $-N$  (エチル)  $-$ であるとき $A^1$ はエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり (ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)、 $Rc$ 中の $p$ が整数2又は3であり、 $A^4$ が単結合又はメチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $Rd$ が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $Re$ がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブ

チルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフエン-2-イル)アミノ基、N-(チオフエン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基であり、

ARがナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフエン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフエン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフエン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピ

ラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）であり、Xaがオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N-ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記（1）に記載の化合物又はその塩。

#### 【0079】

（59-2） 一般式（I）において、ARが芳香環（E）上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環（E）上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>がZxで置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-N（Ry）（Rz）である上記（1）に記載の化合物又はその塩。

#### 【0080】

（60） 一般式（I）において、nが整数2であり、Yが水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基である上記（59-2）に記載の化合物又はその塩。

#### 【0081】

（61） 一般式（I）において、nが整数2であり、ARが芳香環（E）上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環（E）上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>がZxで置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-N（Ry）（Rz）であり、Yが水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基である上記（4）に記載の化合物又はその塩。

#### 【0082】

（62） 一般式（I）において、nが整数2であり、ARが芳香環（E）上のC<sup>3</sup>に

結合しており、R<sub>s</sub>が芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>がZ<sub>x</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、R<sub>s</sub>が-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(5)に記載の化合物又はその塩。

**【0083】**

(63) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいX<sub>a</sub>がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN, N-ジメチルスルファモイル基である上記(59-2)から(62)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

**【0084】**

(64) 一般式(I)において、nが1~3の何れかの整数であり、C<sup>3</sup>がARで結合された炭素原子であり、C<sup>4</sup>がR<sub>s</sub>で結合された炭素原子であり、C<sup>2</sup>、C<sup>5</sup>、及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子であり、R<sub>s</sub>が-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)であり、R<sub>z</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニル

オキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基、イソブチル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基であり、R<sub>y</sub>が水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってこれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基を形成しており、ARがナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピ

リジン-7-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（これらの基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）であり、

Xaはオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N,

N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0085】

(65) 一般式(I)において、nが整数2であり、

C<sup>3</sup>がARで結合された炭素原子であり、C<sup>4</sup>はRsで結合された炭素原子であり、C<sup>2</sup>、C<sup>5</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子であり、

Rsが-N(Ry)(Rz)であり、Rzがブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロ

ピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、*N*-イソプロピルカルバモイル基、*N*-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、*N*-ブチルカルバモイル基、*N*-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、*N*-イソブチルカルバモイル基、*N*-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、*N*-*t*-ブチルカルバモイル基、*N*-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、*N*-シクロプロピルカルバモイル基、*N*-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、*N*-シクロペンチルカルバモイル基、*N*-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、*N*-シクロヘキシルカルバモイル基、*N*-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、*N*-フェニルカルバモイル基、*N*-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノ-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノ-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノ-4-イル)カルボニル基であり、R<sub>y</sub>が水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってこれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基を形成しており、

ARが、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(*N*-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(*N*, *N*-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[*b*]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[*b*]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[*b*]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[*b*]フラン-5-イル基、ベンゾ[*b*]チオフエン-5-イル基、2-メチルベンゾ[*b*]チオフエン-5-イル基、3-メチルベンゾ[*b*]チオフエン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[*b*]チオフエン-5-イル基、1*H*-インドール-5-イル基、2-メチル-1*H*-インドール-5-イル基、3-メチル-1*H*-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1*H*-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1*H*-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1*H*-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1*H*-インドール-5-イル基、1-エチル-1*H*-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1*H*-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1*H*-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1*H*-インドール-5-イル基、1-プロピル-1*H*-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1*H*-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1*H*-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1*H*-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1*H*-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1*H*-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1*H*-インドール-5-



イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0086】

(66) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>が-N(R<sup>n1</sup>)(R<sup>n2</sup>)で置換された炭素原子であり(ただしR<sup>n1</sup>又はR<sup>n2</sup>のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0087】

(67) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>が-N(R<sup>n1</sup>)(R<sup>n2</sup>)で置換された炭素原子であり(ただしR<sup>n1</sup>又はR<sup>n2</sup>のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(4)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0088】

(68) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>が-N(R<sup>n1</sup>)(R<sup>n2</sup>)で置換された炭素原子であり(ただしR<sup>n1</sup>又はR<sup>n2</sup>のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(5)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0089】

(69) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいX<sub>a</sub>がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN, N-ジメチルスルファモイル基である上記(66)から(68)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

#### 【0090】

(70) 一般式(I)において、 $R_s$ が $-O-R_x$ であり、 $R_x$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基の何れかの基であるか、あるいは $R_b$ であり(ただし、 $R_b$ 中の $Q$ がフェニル基又はインダン-2-イル基である)、 $A^1$ が単結合であるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、 $A^2$ は単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-又は $-N$ (エチル)-であるときには、 $A^1$ がエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基で(ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合であるか又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときは、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)である上記(66)から(69)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

# 【0091】

(71) 一般式(I)において、 $n$ が整数2であり、 $C^3$ が $A_R$ で結合された炭素原子であり、 $C^4$ が $R_s$ で結合された炭素原子であり、 $C^5$ が $Z_x$ で置換された炭素原子であり、 $C^2$ 及び $C^6$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $Z_x$ が $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基であり、 $R_s$ が $-O-R_x$ であり、 $R_x$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフ

エニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基であり、

ARがナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0092】

(72) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>と結合しており、C<sup>5</sup>がZxで置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-D-Rcであり、Dが酸素原子又はイオウ原子であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

【0093】

(73) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>がZxで置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-O-Rcであり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(4)に記載の化合物又はその塩。

【0094】

(74) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>がZxで置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-O-Rcであり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(5)に記載の化合物又はその塩。

【0095】

(75) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいXaがメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN、N-ジメチルスルファモイル基である上記(72)から(74)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

【0096】

(76) 一般式(I)において、nが1~3の何れかの整数であり、C<sup>3</sup>がARで結合された炭素原子であり、C<sup>4</sup>がRsで結合された炭素原子であり、C<sup>5</sup>がVで置き換えられていてもよく、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Vが窒素原子であるか、又はZxで置換された炭素原子であり、Zxがフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N、N-ジメチルアミノ基、N、N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN、N-ジメチルスルファモイルアミノ基であり、

Rsが-D-Rcであり、Dが酸素原子又はイオウ原子であり、Rc中のpが整数2又は3であり、A<sup>4</sup>が単結合又はメチレンであり、A<sup>5</sup>が-C(O)-、-C(S)-、又は-S

(O)<sub>2</sub>-であり、Rdが水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ペンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、Reがメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフ

エン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基であり、ARがナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1,2,5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1,2,5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1,3-ジヒドロピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1,3-ジヒドロピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル基、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1,8]ナフ

タリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい）であり、X<sub>a</sub>がオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N-ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記（1）に記載の化合物又はその塩。

【0097】

（77） 一般式（I）において、nが整数2であり、

C<sup>3</sup>がARで結合された炭素原子であり、C<sup>4</sup>がR<sub>s</sub>で結合された炭素原子であり、C<sup>5</sup>がVで置き換えられていてもよく、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Vが窒素原子であるか、又はZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、Z<sub>x</sub>が、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基であり、

R<sub>s</sub>が-O-R<sub>c</sub>であり、R<sub>c</sub>中のpが整数2であり、A<sup>4</sup>が単結合又はメチレンであり、A<sup>5</sup>が-C(O)-、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-であり、R<sub>d</sub>がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、又は4-フルオロフェニルメチル基であり、R<sub>e</sub>がイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基であり、

ARが、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-

ーインダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0098】

(78) 一般式(I)において、nが整数2であり、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、Rsが芳香環(E)上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>がZ<sub>x</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、Yが水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基である上記(7)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0099】

(79) 一般式(I)において、AR上に置換していてもよいX<sub>a</sub>がメチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、カルバモイル基、アセチル基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、又はN, N-ジメチルスルファモイル基である上記(78)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0100】

(80) 一般式(I)において、Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、R<sub>x</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、又はシクロヘキシルメチル基を示すか、あるいはR<sub>b</sub>であり(ただし、R<sub>b</sub>中のQがフェニル基又はインダン-2-イル基である)、A<sup>1</sup>が単結合であるか、あるいはメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のメチレン基、又はメチル基若しくはエチル基で置換されているか又は無置換のエチレン基であり、A<sup>2</sup>が単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-であり(ただしA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-であるときには、A<sup>1</sup>がエチレンである)、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、又はジメチルアミノ基(ただしQがフェニル基であり、A<sup>1</sup>が単結合又は無置換のメチレンであり、かつA<sup>2</sup>が単結合であるときは、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)である上記(78)又は(79)のいずれかに記載の化合物又はその塩。

#### 【0101】

(81) 一般式(I)において、nが1~3の何れかの整数であり、C<sup>3</sup>がARで結合された炭素原子であり、C<sup>4</sup>がRsで結合された炭素原子であり、C<sup>5</sup>がVで置換されてもよく、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Vが窒素原子であるか、あるいはZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、Z<sub>x</sub>がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基であり、

Rsが-O-R<sub>x</sub>であり、R<sub>x</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいはR<sub>b</sub>又はR<sub>c</sub>であり、R<sub>b</sub>中のQがフェニル基、チエニル基、フリル基、ピ



リジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 又は $-N$  (エチル)  $-$ であり (ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は $-N$  (エチル)  $-$ であるときには $A^1$ がエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり (ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)、 $R^c$ 中の $p$ が整数2又は3であり、 $A^4$ が単結合又はメチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 又は $-S(O)_2-$ であり、 $R^d$ が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $R^e$ がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-フルオロフェニル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-3-イル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-4-イル)アミノ基、 $N$ -(フラン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(フラン-3-イル)アミノ基、 $N$ -(チオフェン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基であり、

$AR$ がシンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2- $b$ ]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2- $b$ ]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3- $b$ ]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3- $b$ ]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ

-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基(上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよい)、X<sup>a</sup>がオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、

Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記(1)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0102】

(82) 一般式(I)において、ARが芳香環(E)上のC<sup>3</sup>に結合しており、R<sub>s</sub>が芳香環(E)上のC<sup>4</sup>に結合しており、C<sup>5</sup>がZ<sub>x</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、R<sub>s</sub>が-O-R<sub>x</sub>であり、R<sub>x</sub>が炭素数3~8個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基であるか、あるいはR<sub>a</sub>又はR<sub>b</sub>である上記(6)に記載の化合物又はその塩。

#### 【0103】

(83) 一般式(I)において、Z<sub>x</sub>がフッ素原子、塩素原子、ニトロ基、アミノ基、メチル基、又はOR<sup>9</sup>である上記(82)に記載の化合物又はその塩。

## 【0104】

(84) 一般式 (I) において、 $n$  が 1~3 の何れかの整数であり、 $AR$  が  $C^3$  に結合しており、 $Rs$  が  $C^4$ 、 $C^5$ 、又は  $C^6$  の何れかの環構成炭素原子に結合しており、 $C^4$ 、 $C^5$ 、又は  $C^6$  のうち  $Rs$  が結合していない環構成炭素原子は  $V$  で置き換えられていてもよく、

$V$  が窒素原子又は  $Zx$  で置換された炭素原子であり、 $Zx$  がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基であり、 $Rs$  が  $-D-Rx$  又は  $-N(Ry)(Rz)$  であり、 $D$  が酸素原子又はイオウ原子であり、 $Rx$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は 2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいは  $Rb$  又は  $Rc$  であり、 $Rb$  中の  $Q$  がフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$  が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  であり (ただし  $A^2$  が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、 $-N$  (エチル)  $-$  であるとき  $A^1$  はエチレンである)、 $R^2$  及び  $R^3$  がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基である (ただし  $Q$  がフェニル基であり、 $A^1$  が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ  $A^2$  が単結合であるときには、 $R^2$  又は  $R^3$  のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、 $Rc$  中の  $p$  が整数 2 又は 3 であり、 $A^4$  が単結合又はメチレンであり、 $A^5$  が  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は  $-S(O)_2-$  であり、 $Rd$  が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $Re$  がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ - (4-メチルフェニル) アミノ基、 $N$ - (4-クロロフェニル) アミノ基、 $N$ - (4-フルオロフェニル) アミノ基、 $N$ - (ピリジン-2-イル) アミノ基、 $N$ - (ピリジン-3-イル) アミノ基、 $N$ - (ピリジン-4-イル) アミノ基、 $N$ - (フラン-2-イル) アミノ基、 $N$ - (フラン-3-イル) アミノ基、 $N$ - (チオフェン-2-イル) アミノ基、 $N$ - (チオフェン-3-イル) アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メ

チルオキシカルボニルアミノ基又はエチルオキシカルボニルアミノ基でありR<sub>2</sub>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカ

ルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー-4-イル)カルボニル基でありR<sub>y</sub>は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基であり、ARがナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H

ーベンゾオキサゾールー6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾールー7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾールー5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾールー4-イル基、フタラジンー6-イル基、フタラジンー5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジンー3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジンー4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジンー3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジンー4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジンー6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジンー4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジンー5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジンー4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジンー5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジンー6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジンー6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジンー4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジンー5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジンー4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジンー5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジンー4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジンー6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジンー7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジンー2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジンー3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジンー6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジンー2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジンー3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジンー5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジンー6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾールー5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾールー4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾールー5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾールー4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾールー6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾールー7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾールー5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾールー4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾールー6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾールー7-イル基、インドリジンー7-イル基、インドリジンー6-イル基、インドリジンー8-イル基、1, 3-ジヒドロインドールー5-イル基、1, 3-ジヒドロインドールー4-イル基、1, 3-ジヒドロインドールー6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾールー5-イル基、2H-イソインドールー5-イル基、2H-イソインドールー4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジンー6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジンー5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジンー5-イル基、7H-プリンー2-イル基、4H-クロメンー6-イル基、又は4H-クロメンー5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）、Xaがオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フランー2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N-ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、Yが水素原子、メチル基、又はエチル基である上記（1）に記載の化合物又はその塩。

【0105】

（85） 前記一般式（I）で表される化合物又はその薬理学上許容される塩を有効成分として含む医薬。

【0106】

（86） 前記一般式（I）で表される化合物又はその薬理学上許容される塩を有効成分として含むプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生抑制剤。

【0107】

（87） プロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生により惹起される疾患

の予防及び／又は治療のための上記（８５）に記載の医薬。

【0108】

（８８） 哺乳動物の炎症性疾患の予防及び／又は治療のための上記（８５）に記載の医薬。

【0109】

（８９） 哺乳動物の自己免疫疾患の予防及び／又は治療のための上記（８５）に記載の医薬。

【0110】

（９０） 哺乳動物のアレルギー性疾患の予防及び／又は治療のための上記（８５）に記載の医薬。

【0111】

（９１） 哺乳動物の解熱及び／又は鎮痛のための上記（８５）に記載の医薬。

【0112】

（９２） 哺乳動物における急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態の予防及び／又は治療のための医薬組成物であって、上記予防及び／又は治療に有効な量の前記一般式（Ⅰ）で表される化合物又はその薬学的に許容される塩及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【0113】

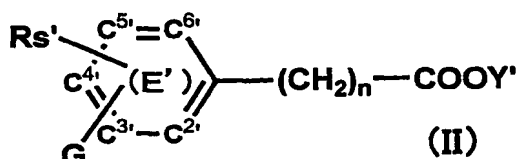
（９３） 哺乳動物における急性又は慢性の炎症反応が認められる生体状態の予防及び／又は治療方法であって、上記予防及び／又は治療に有効な量の前記一般式（Ⅰ）で表される化合物又はその薬学的に許容される塩を該哺乳動物に投与する工程を含む方法。

【0114】

（９４） 下記式（Ⅱ）：

【0115】

【化４】



〔式中、芳香環（E'）上のC<sup>2'</sup>、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>、及びC<sup>6'</sup>はそれぞれ環構成炭素原子を示し、それらのうちでR<sub>s</sub>'又はGが結合していない何れか一つはV'で置き換えられていてもよく、

V'は窒素原子を示すか、あるいはZ<sub>x</sub>'で置換された炭素原子を示し、Z<sub>x</sub>'は、前述のZ<sub>x</sub>と同義であり、ただしZ<sub>x</sub>が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、Z<sub>x</sub>がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよく、

R<sub>s</sub>'は-D-R<sub>x</sub>'又は-N(R<sub>y</sub>')(R<sub>z</sub>')を示し、-D-R<sub>x</sub>'及び-N(R<sub>y</sub>')(R<sub>z</sub>')はそれぞれ前述の-D-R<sub>x</sub>及び-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)と同義であり、ただし-D-R<sub>x</sub>又は-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、-D-R<sub>x</sub>又は-N(R<sub>y</sub>)(R<sub>z</sub>)がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよく、

Gは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メシラート基、トリフラート基、又は芳香環部分が１個又は同一若しくは異なる２個以上のT<sup>1</sup>で置換されていてもよいアレーンスルホネート基を示し、

Y'は炭素数１～４個の低級アルキル基を示す〕で表される化合物。

【0116】

（９５） 一般式（Ⅱ）において、Gが芳香環（E'）上のC<sup>2'</sup>又はC<sup>3'</sup>の何れかの環構成炭素原子に結合している上記（９４）に記載の化合物。

【0117】

(96) 一般式 (I I) において、 $n$  が整数 2 である上記 (94) 又は (95) のいずれかに記載の化合物。

【0118】

(97) 一般式 (I I) において、 $R_{s'}$  が  $-O-R_{x'}$  である上記 (94) から (96) のいずれかに記載の化合物。

【0119】

(98) 一般式 (I I) において、 $R_{s'}$  が  $-D-R_{x'}$  又は  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  であり、 $D$  が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は  $-C(O)-$  であり、 $R_{x'}$  が炭素数 3~8 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基であるか、あるいは  $R_a$ 、 $R_b$ 、又は  $R_c$  であり、 $R_a$  中の  $k$  が 0 又は 1~3 の何れかの整数であり、 $R^1$  が炭素数 3~7 個の環状飽和アルキル基又は炭素数 6~8 個の縮合環式飽和アルキル基であり、 $R^1$  は 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の炭素数 1~4 の低級アルキル基で置換されてもよく、 $R_b$  中の  $Q$  が環上の任意の位置で  $A^2$  に結合しているフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H-クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール基、又はジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール基であり、 $A^1$  が単結合又は炭素数 1~3 個のアルキレン ( $a$ ) であり、アルキレン ( $a$ ) が炭素数 1~4 個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されてもよく、 $A^2$  が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は  $-N(R^4)-$  であり (ただし  $A^2$  が酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は  $-N(R^4)-$  であるときには、 $A^1$  はエチレン又はトリメチレンである)、 $R^2$  及び  $R^3$  はそれぞれ独立に水素原子、炭素数 1~4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、 $-OR^5$ 、 $-N(R^6) (R^{6'})$ 、 $-NHCOR^7$ 、 $-NH SO_2 R^8$ 、 $-A^6-Q_a$  であるか、あるいはこれらがともに繋がってメチレンジオキシ基を形成し、 $Q_a$  は 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の  $T^1$  で置換されていてよく、環上の任意の位置で  $A^6$  に結合したフェニル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、又はインダゾリル基であり、 $R^4$  及び  $R^6$  がそれぞれ独立に水素原子又は炭素数 1~4 個の低級アルキル基であり、 $R^5$  及び  $R^7$  がそれぞれ独立に水素原子又は炭素数 1~4 個の低級アルキル基又は  $-A^6-Q_a$  であり、 $R^8$  が炭素数 1~4 個の低級アルキル基であり、 $R^{6'}$  が  $R^6$  と同義であるか、あるいは  $R^6$  と繋がってこれらが結合する窒素原子とともに 3~6 員環を形成して含窒素飽和シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しており、 $R_c$  中の  $p$  が 2~4 の何れかの整数であり、 $A^4$  が単結合あるいはメチレン又はエチレンであり、 $A^5$  が  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は  $-S(O)_2-$  であり、 $R_d$  が水素原子、炭素数 1~8 個のアルキル基、又は  $Q_a$  であり、 $R_e$  が炭素数 1~8 個のアルキル基、 $-A^6-Q_a$ 、 $-(CH_2)_i R^{14}$ 、 $-OR^{28}$ 、 $-SR^{28}$ 、又は  $-N(R^{29}) (R^{30})$  であり、 $i$  が 1~3 の何れかの整数であり、 $R^{14}$  が水酸基、炭素数 1~4 個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数 1~4 個の  $N$ 、 $N$ -ジアルキルカルバモイル基であり、 $R^{28}$  が炭素数 1~8 個のアルキル基又は  $-A^6-Q_a$  であり、 $R^{29}$  が炭素数 1~8 個のアルキル基、炭素数 1~4 個のアルコキシカルボニル基、又は  $-A^6-Q_a$  であり、 $R^{30}$  は水素原子又は炭素数 1~4 個の低級アルキル基で



あるか、あるいは $R^{29}$ と繋がってこれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して含窒素飽和シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しており、 $R_{z'}$ が $R_{x'}$ と同義であるか、あるいは $-A^5-R_e$ であり、 $R_{y'}$ が水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は $-A^6-Q_p$ であるか、あるいは $R_{z'}$ と繋がってこれらが結合する窒素原子とともに原子数3～7の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成しており、 $-D-R_{x'}$ 又は $-N(R_{y'})$  ( $R_{z'}$ ) が水酸基を含む場合には、その水酸基は $R_{p^1}$ で保護されていてもよく、 $-D-R_{x'}$  又は $-N(R_{y'})$  ( $R_{z'}$ ) がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は $R_{p^2}$ で保護されていてもよい上記(94)から(97)のいずれかに記載の化合物。

# 【0120】

(99) 一般式(II)において、 $n$ が1～3の何れかの整数であり、 $G$ が $C^{3'}$ に結合しており、 $R_{s'}$ が $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、又は $C^{6'}$ の何れかの環構成炭素原子に結合しており、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、又は $C^{6'}$ のうち $R_{s'}$ が結合していない環構成炭素原子は $V'$ で置き換えられていてもよく、 $V'$ が窒素原子又は $Z_{x'}$ で置換された炭素原子であり、 $Z_{x'}$ がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基であり、ただし $Z_{x'}$ が水酸基を含む場合には、その水酸基は $R_{p^1}$ で保護されていてもよく、また、 $Z_{x'}$ がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は $R_{p^2}$ で保護されていてもよく、 $R_{s'}$ が $-D-R_{x'}$  又は $-N(R_{y'})$  ( $R_{z'}$ ) であり、 $D$ が酸素原子又はイオウ原子であり、 $R_{x'}$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいは $R_b$ 又は $R_c$ であり、 $R_b$ 中の $Q$ がフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-又は $-N$ (エチル)-であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であるとき $A^1$ はエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり(ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、 $R_c$ 中の $p$ が整数2又は3であり、 $A^4$ が単結合又はメチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $R_d$ が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $R_e$ がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロ

ピロキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基又はエチルオキシカルボニルアミノ基でありR<sub>2</sub>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチ

リル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、*N*-イソプロピルカルバモイル基、*N*-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、*N*-ブチルカルバモイル基、*N*-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、*N*-イソブチルカルバモイル基、*N*-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、*N*-*t*-ブチルカルバモイル基、*N*-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、*N*-シクロプロピルカルバモイル基、*N*-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、*N*-シクロペンチルカルバモイル基、*N*-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、*N*-シクロヘキシルカルバモイル基、*N*-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、*N*-フェニルカルバモイル基、*N*-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー-4-イル)カルボニル基であり  $R_y$  は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいは  $R_z$  と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基を形成し、ただし  $-D-R_{x'}$  又は  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R_{p^1}$  で保護されていてもよく、また、 $-D-R_{x'}$  又は  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $R_{p^2}$  で保護されていてもよく、

$G$  は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、又はトリフラート基であり、

$Y'$  はメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0121】

(100) 一般式(II)において、 $R_{s'}$  が  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  である上記(94)から(96)のいずれかに記載の化合物。

#### 【0122】

(101) 一般式(II)において、 $R_{s'}$  が  $-D-R_{x'}$  であり、 $D$  がイオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$  又は  $-C(O)-$  である上記(94)から(96)のいずれかに記載の化合物。

#### 【0123】

(102) 一般式(II)において、 $G$  が芳香環( $E'$ )上の  $C^{2'}$  の位置に結合しており、 $R_{s'}$  が  $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$  又は  $C^{5'}$  のうちの何れか一つの環構成炭素原子に結合しており、芳香環( $E'$ )において  $C^{2'}$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$  及び  $C^{6'}$  はいずれも  $V'$  で置き換えられていない上記(94)に記載の化合物。

#### 【0124】

(103) 一般式(II)において、 $n$  が1~3の何れかの整数であり、

GがC<sup>2'</sup>に結合しており、R s'がC<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、又はC<sup>5'</sup>の何れかの環構成炭素原子に結合しており、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、又はC<sup>5'</sup>のうちR s'が結合していない環構成炭素原子はV'で置換されていてもよく、

V'が窒素原子であるか、又はZ x'で置換された炭素原子であり、Z x'がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基であり、ただしZ x'が水酸基を含む場合には、その水酸基はR p<sup>1</sup>で保護されていてもよく、Z x'がアミノ基を含む場合、そのアミノ基はR p<sup>2</sup>で保護されていてもよく、

R s'が-D-R x'又は-N(R y')(R z')であり、Dが酸素原子又はイオウ原子であり、R x'がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基あるいはR b又はR cでありR b中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、A<sup>2</sup>が単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-であり(ただしA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-であるときA<sup>1</sup>がエチレンである)、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり(ただしQがフェニル基であり、A<sup>1</sup>が単結合又は無置換のメチレンであり、かつA<sup>2</sup>が単結合であるときには、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)、R c中のpが整数2又は3であり、A<sup>4</sup>が単結合又はメチレンであり、A<sup>5</sup>が-C(O)-、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-であり、R dが水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、R eがメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-

(チオフェン-3-イル) アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基であり、R<sub>2</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカ

ルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基でありR<sub>y</sub>は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基であり、ただし-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') が水酸基を含む場合、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') がアミノ基を含む場合、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよく、Gが塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、又はトリフラート基であり、Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0125】

(104) 一般式(II)において、nが整数2であり、R<sub>s</sub>' が芳香環(E')上のC<sup>3</sup>' に結合しており、R<sub>s</sub>' が-O-R<sub>x</sub>' であり、Y' がメチル基又はエチル基である上記(102)又は(103)のいずれかに記載の化合物。

#### 【0126】

(105) 一般式(II)において、nが整数2であり、C<sup>2</sup>' がGで結合された環構成炭素原子であり、C<sup>3</sup>' がR<sub>s</sub>' で結合された環構成炭素原子であり、C<sup>4</sup>' がV' で置き換えられていてもよく、C<sup>5</sup>' 及びC<sup>6</sup>' が無置換の環構成炭素原子であり、V' が窒素原子であるか、あるいはZ<sub>x</sub>' で置換された炭素原子であり、Z<sub>x</sub>' がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN、N-ジメチルアミノ基であり、ただしZ<sub>x</sub>' が水酸基を含む場合、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、Z<sub>x</sub>' がアミノ基を含む場合、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよく、R<sub>s</sub>' が-O-R<sub>x</sub>' であり、R<sub>x</sub>' がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロ

フェニル) エチル基、1-(4-フルオロフェニル) エチル基、1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、1-(4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、2-(4-メチルフェニル) エチル基、2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基であり、

Gが臭素原子又はヨウ素原子であり、

Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0127】

(106) 一般式(II)において、nが整数2であり、R<sub>s</sub>' が芳香環(E') 上のC<sup>4</sup>' の位置に結合しており、R<sub>s</sub>' が-O-R<sub>x</sub>' であり、Y' がメチル基又はエチル基である上記(102)又は(103)のいずれかに記載の化合物。

#### 【0128】

(107) 一般式(II)において、nが整数2であり、C<sup>2</sup>' がGで結合された環構成炭素原子であり、C<sup>4</sup>' がR<sub>s</sub>' で結合された環構成炭素原子であり、C<sup>5</sup>' はV' で置き換えられていてもよく、C<sup>3</sup>' 及びC<sup>6</sup>' が無置換の環構成炭素原子であり、

V' が窒素原子であるか、あるいはZ<sub>x</sub>' で置換された炭素原子であり、Z<sub>x</sub>' がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基であり、ただしZ<sub>x</sub>' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、Z<sub>x</sub>' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよく、

R<sub>s</sub>' が-O-R<sub>x</sub>' であり、R<sub>x</sub>' がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロイン

ダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、  
 Gが臭素原子又はヨウ素原子であり、  
 Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0129】

(108) 一般式(II)において、nが整数2であり、R s' が芳香環(E')上のC<sup>5'</sup>の位置に結合しており、R s' が-O-R x'であり、Y' がメチル基又はエチル基である上記(102)又は(103)のいずれかに記載の化合物。

#### 【0130】

(109) 一般式(II)において、Gが芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、R s' が芳香環(E')上のC<sup>5'</sup>又はC<sup>6'</sup>のうちの何れかに結合しており、芳香環(E')においてC<sup>2'</sup>、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>及びC<sup>6'</sup>はいずれもV'で置き換えられていない上記(94)に記載の化合物。

#### 【0131】

(110) 一般式(II)において、nが整数2であり、R s' が芳香環(E')上のC<sup>5'</sup>に結合しており、R s' が-O-R x'である上記(109)に記載の化合物。

#### 【0132】

(111) 一般式(II)において、nが整数2であり、C<sup>3'</sup>がGで結合された炭素原子であり、C<sup>5'</sup>がR s'で結合された炭素原子であり、C<sup>2'</sup>、C<sup>4'</sup>、及びC<sup>6'</sup>は無置換の環構成炭素原子であり、R s' が-O-R x'であり、R x' がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフ



エニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、  
 3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルイン  
 ダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-  
 イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、  
 5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-  
 ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロイン  
 ダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン  
 -2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基  
 、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基  
 、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロ  
 フェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニ  
 ル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチ  
 ル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニル  
 メチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-  
 フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメ  
 チル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニ  
 ルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル  
 基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2,  
 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロ  
 フェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチ  
 ル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(  
 トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基  
 、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基  
 、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(  
 2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-  
 メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フル  
 オロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフ  
 エニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)  
 エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフ  
 ルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチ  
 ル基、2-[4-(N,N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシ  
 エチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ  
 )エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチ  
 ル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基又は2-(N-エチル-N-フ  
 エニルアミノ)エチル基であり、

Gが臭素原子又はヨウ素原子であり、

Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0133】

(112) 一般式(II)において、nが整数2であり、Rs' が芳香環(E')上  
 のC<sup>6'</sup>に結合しており、Rs' が-O-Rx'である上記(109)に記載の化合物。

#### 【0134】

(113) 一般式(II)において、Gが芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、  
 Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>6'</sup>はV'である上記(94)に記  
 載の化合物。

#### 【0135】

(114) 一般式(II)において、nが整数2であり、V'がZx'で置換された  
 炭素原子であり、Rs' が-O-Rx'である上記(113)に記載の化合物。

#### 【0136】

(115) 一般式(II)において、nが整数2であり、  
 C<sup>3'</sup>がGで結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がRs'で結合された炭素原子であり、C

$6'$  が  $Zx'$  で置換された炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{5'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、

$Zx'$  がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基であり、ただし  $Zx'$  が水酸基を含む場合、その水酸基は  $Rp^1$  で保護されていてもよく、 $Zx'$  がアミノ基を含む場合、そのアミノ基は  $Rp^2$  で保護されていてもよく、

$Rs'$  が  $-O-Rx'$  であり、 $Rx'$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-( $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-( $N$ -フェニル- $N$ -メチルアミノ)エチル基、又は2-( $N$ -エチル- $N$ -フェニルアミノ)エチル基であり、

$G$  が臭素原子又はヨウ素原子であり、

$Y'$  がメチル基又はエチル基である上記 (94) に記載の化合物。

#### 【0137】

(116) 一般式 (II) において、 $G$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  が窒素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子である上記 (94) に記載の化合物。

## 【0138】

(117) 一般式 (I I) において、 $n$  が整数 2 であり、 $R_{s'}$  が  $-O-R_{x'}$  である上記 (116) に記載の化合物。

## 【0139】

(118) 一般式 (I I) において、 $n$  が整数 2 であり、 $C^{3'}$  が  $G$  で結合された炭素原子であり、 $C^{4'}$  が  $R_{s'}$  で結合された炭素原子であり、 $C^{5'}$  が窒素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$  が  $-O-R_{x'}$  であり、 $R_{x'}$  は、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、 $G$  が臭素原子又はヨウ素原子であり、 $Y'$  がメチル基又はエチル基である上記 (94) に記載の化合物。

## 【0140】

(119) 一般式 (I I) において、 $G$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $R_{s'}$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  が  $Z_{x'}$  で置換されるか、又

は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$  が  $-D-R_{x'}$  であり、 $D$  は単結合、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は  $-C(O)-$  である上記 (94) に記載の化合物。

【0141】

(120) 一般式 (II) において、 $n$  が整数2であり、

$C^{3'}$  が  $G$  で結合された炭素原子であり、 $C^{4'}$  が  $R_{s'}$  で結合された炭素原子であり、 $C^{5'}$  が  $Z_{x'}$  で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、

$Z_{x'}$  がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基であり、ただし  $Z_{x'}$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R_{p^1}$  で保護されていてもよく、 $Z_{x'}$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $R_{p^2}$  で保護されていてもよく、

$R_{s'}$  が  $-S-R_{x'}$  であり、 $R_{x'}$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-( $N$ ,  $N$ -ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-( $N$ -フェニル- $N$ -メチルアミノ)エチル基、又は2-( $N$ -エチル- $N$ -フェニルアミノ)エチル基であり、

Gが臭素原子又はヨウ素原子であり、  
Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

【0142】

(121) 一般式(II)において、Gが芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、R<sub>s'</sub>が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZ<sub>x'</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、R<sub>s'</sub>が-N(R<sub>y'</sub>)(R<sub>z'</sub>)である上記(94)に記載の化合物。

【0143】

(122) 一般式(II)において、nが整数2であり、  
C<sup>3'</sup>がGで結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がR<sub>s'</sub>で結合された炭素原子であり、C<sup>5'</sup>がZ<sub>x'</sub>で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、

Z<sub>x'</sub>がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基又はN, N-ジメチルアミノ基であり、ただしZ<sub>x'</sub>が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、Z<sub>x'</sub>がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよく、

R<sub>s'</sub>が-N(R<sub>y'</sub>)(R<sub>z'</sub>)であり、R<sub>z'</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フ

エニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、N-*t*-ブチルカルバモイル基、N-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー-4-イル)カルボニル基であり、Ry' は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはRz' と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基を形成しており、ただし-N(Ry')(Rz') が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、-N(Ry')(Rz') がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよく、

Gが臭素原子又はヨウ素原子であり、

Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0144】

(123) 一般式(II)において、nが整数2であり、Gが芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>が-N(Rn<sup>1</sup>)(Rn<sup>2</sup>)基で置換された炭素原子であり(ただしRn<sup>1</sup>又はRn<sup>2</sup>のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-O-Rx'である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0145】

(124) 一般式(II)において、nが整数2であり、C<sup>3'</sup>がGで結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がRs'で結合された炭素原子であり、C<sup>5'</sup>がZx'で置換された炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Zx'がN-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソブ

ロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基であり、ただしZ x' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR p<sup>2</sup>で保護されていてもよく、

R s' が-O-R x' であり、R x' がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、

Gが臭素原子又はヨウ素原子であり、

Y' がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

#### 【0146】

(125) 一般式(II)において、Gが芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、R s' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZ x'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、R s' が-D-R x'であり、R x'がR cと同義であり、ただしR cが水酸基を含む場合には、その水酸基はR p<sup>1</sup>で保護されていてもよく、R cがアミノ基を含む場合には、そ

のアミノ基は $R_p^2$ で保護されていてもよい上記(94)に記載の化合物。

【0147】

(126) 一般式(II)において、 $n$ が整数2であり、 $C^{3'}$ が $G$ で結合された炭素原子であり、 $C^{4'}$ が $R_{s'}$ で結合された炭素原子であり、 $C^{5'}$ が $Z_{x'}$ で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$ 及び $C^{6'}$ は無置換の環構成炭素原子であり、

$Z_{x'}$ がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基であり、ただし $Z_{x'}$ が水酸基を含む場合には、その水酸基は $R_p^1$ で保護されていてもよく、 $Z_{x'}$ がアミノ基を含む場合、そのアミノ基は $R_p^2$ で保護されていてもよく、

$R_{s'}$ が $-O-R_{x'}$ であり、 $R_{x'}$ が $R_c$ と同義であり、ただし $R_c$ が水酸基を含む場合には、その水酸基は $R_p^1$ で保護されていてもよく、 $R_c$ 中の $p$ が整数2であり、 $A^4$ が単結合又はメチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $R_d$ がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、又は4-フルオロフェニルメチル基であり、 $R_e$ がイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基であり、

$G$ が臭素原子又はヨウ素原子であり、

$Y'$ がメチル基又はエチル基である上記(94)に記載の化合物。

【0148】

(127) 一般式(II)において、 $G$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{3'}$ に結合しており、 $R_{s'}$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{4'}$ に結合しており、 $C^{5'}$ が $Z_{x'}$ で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$ 及び $C^{6'}$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$ が $-O-R_{x'}$ であり、 $R_{x'}$ が炭素数3~8個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基であるか、あるいは $R_a$ 又は $R_b$ である上記(94)に記載の化合物。

【0149】

(128) 一般式(II)において、 $n$ が整数2であり、 $G$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{3'}$ に結合しており、 $R_{s'}$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{4'}$ に結合しており、 $C^{5'}$ がニトロ基で置換された炭素原子であり、 $C^{2'}$ 及び $C^{6'}$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$ が $-O-R_{x'}$ である上記(94)に記載の化合物。

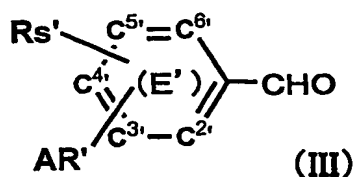
【0150】

(129) 下記式(III)：

【0151】



## 【化5】



〔式中、芳香環 (E') 上の C<sup>2'</sup>、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>、又は C<sup>6'</sup> は環構成炭素原子を示し、これらのうち R s'、又は A R' が結合していない何れか一つは V' で置き換えられていてもよく、A R' は A R と同義であり、ただし A R が水酸基を含む場合には、その水酸基は R p<sup>1</sup> で保護されていてもよく、A R がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は R p<sup>2</sup> で保護されていてもよい。〕で表される化合物。

## 【0152】

(130) 一般式 (I I I) において、A R' が芳香環 (E') 上の C<sup>2'</sup>、又は C<sup>3'</sup> の何れかの原子に結合している上記 (129) に記載の化合物。

## 【0153】

(131) 一般式 (I I I) において、A R' がナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ [b] チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3 H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1 H-キノリン、ベンゾ [d] イソチアゾール、1 H-インダゾール、ベンゾ [c] イソチアゾール、2 H-インダゾール、イミダゾ [1, 2-a] ピリジン、1 H-ピロロ [2, 3-b] ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ-2 H-イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1 H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1 H-ピロロ [3, 2-b] ピリジン、ベンゾ [1, 2, 5] チアジアゾール、1 H-ベンゾトリアゾール、1, 3-ジヒドロピロロ [2, 3-b] ピリジン、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ-3 H-ベンゾオキサゾール、フタラジン、[1, 8] ナフタリジン、[1, 5] ナフタリジン、1 H-ピロロ [3, 2-c] ピリジン、1 H-ピロロ [2, 3-c] ピリジン、1 H-ピラゾロ [4, 3-b] ピリジン、1 H-ピラゾロ [4, 3-c] ピリジン、1 H-ピラゾロ [3, 4-c] ピリジン、1 H-ピラゾロ [3, 4-b] ピリジン、[1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-a] ピリジン、チエノ [3, 2-c] ピリジン、チエノ [3, 2-b] ピリジン、1 H-チエノ [3, 2-c] ピラゾール、ベンゾ [d] イソオキサゾール、ベンゾ [c] イソオキサゾール、インドリジン、1, 3-ジヒドロインドール、1 H-ピラゾロ [3, 4-d] チアゾール、2 H-イソインドール、[1, 2, 4] トリアゾロ [1, 5-a] ピリミジン、1 H-ピラゾロ [3, 4-b] ピラジン、1 H-イミダゾ [4, 5-b] ピラジン、7 H-プリン、又は 4 H-クロメンの残基 (上記の残基は 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の X a で置換されていてもよく、A R' が水酸基を含む場合には、その水酸基は R p<sup>1</sup> で保護されていてもよく、A R' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は R p<sup>2</sup> で保護されていてもよい) である上記 (129) 又は (130) のいずれかに記載の化合物。

## 【0154】

(132) 一般式 (I I I) において、A R' がナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、ベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、ベンゾ [b] チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3 H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3 H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3 H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3 H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1 H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1 H-キノリン-5-イル基、ベンゾ [d] イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ [d] イソチ

アゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン

ー5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよく、AR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい）である上記（129）又は（130）のいずれかに記載の化合物。

**【0155】**

（133）一般式（III）において、AR' がナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ〔b〕チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ〔d〕イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ〔c〕イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン、イソキノリン、又はジヒドロ-2H-イソキノリンの残基（上記の残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよく、AR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい）である上記（129）又は（130）のいずれかに記載の化合物。

**【0156】**

（134）一般式（III）において、AR' がシンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール、1H-ベンゾトリアゾール、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール、フタラジン、〔1, 8〕ナフタリジン、〔1, 5〕ナフタリジン、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール、インドリジン、1, 3-ジヒドロインドール、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール、2H-イソインドール、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン、7H-プリン、又は4H-クロメンの残基（上記の残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよく、AR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい）である上記（129）又は（130）のいずれかに記載の化合物。

**【0157】**

（135）一般式（III）において、R<sup>s'</sup> が-O-R<sup>x'</sup> である上記（129）から（134）のいずれかに記載の化合物。

**【0158】**

（136）一般式（III）において、R<sup>s'</sup> が-D-R<sup>x'</sup> あるいは-N(R<sup>y'</sup>)(R<sup>z'</sup>)であり、Dが単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-であり、R<sup>x'</sup> が炭素数3～8個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基であるか、あるいはR<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、又はR<sup>c</sup>であり、R<sup>a</sup>中のkが0又は1～3の何れかの整数であり、R<sup>1</sup>が炭素数3～7個の環状飽和アルキル基又は炭素数6～8個の縮合環式飽和アルキル基であり、R<sup>1</sup>が1個又は同一若しくは異なる2個以上の炭素数1～4の低級アルキル基で置換されていてもよく、R<sup>b</sup>中のQが環上の任意の位置でA<sup>2</sup>に結合したフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾ

オキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H-クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール基、又はジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール基であり、 $A^1$ が単結合又は炭素数1~3個のアルキレン( $a$ )であり、アルキレン( $a$ )は炭素数1~4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換されていてもよく、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-N(R^4)-$ であるときには、 $A^1$ がエチレン又はトリメチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ独立に水素原子、炭素数1~4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、 $-OR^5$ 、 $-N(R^6)(R^{6'})$ 、 $-NHCOR^7$ 、 $-NH SO_2 R^8$ 、又は $-A^6-Q_a$ であるか、あるいはこれらが繋がってメチレンジオキシ基を形成し、 $Q_a$ が1個又は同一若しくは異なる2個以上の $T^1$ で置換されていてもよく、環上の任意の位置で $A^6$ に結合したフェニル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、又はインダゾリル基であり、 $R^4$ 及び $R^6$ がそれぞれ独立に水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基であり、 $R^5$ 及び $R^7$ がそれぞれ独立に水素原子、炭素数1~4個の低級アルキル基、又は $-A^6-Q_a$ であり、 $R^8$ が炭素数1~4個の低級アルキル基であり、 $R^{6'}$ は $R^6$ と同義であるか、あるいは $R^6$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3~6員環を形成して飽和含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しており、 $R_c$ 中の $p$ が2~4の何れかの整数であり、 $A^4$ が単結合あるいはメチレン又はエチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $R_d$ が水素原子、炭素数1~8個のアルキル基、又は $Q_a$ であり、 $R_e$ が炭素数1~8個のアルキル基、 $-A^6-Q_a$ 、 $-(CH_2)_i R^{14}$ 、 $-OR^{28}$ 、 $-SR^{28}$ 、又は $-N(R^{29})(R^{30})$ であり、 $i$ が1~3の何れかの整数であり、 $R^{14}$ が水酸基、炭素数1~4個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数1~4個の $N$ 、 $N$ -ジアルキルカルバモイル基であり、 $R^{28}$ が炭素数1~8個のアルキル基又は $-A^6-Q_a$ であり、 $R^{29}$ が炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~4個のアルコキシカルボニル基、又は $-A^6-Q_a$ であり、 $R^{30}$ が水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基であるか、あるいは $R^{29}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3~6員環を形成して飽和含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しており、 $R_{z'}$ が $R_{x'}$ と同義であるか、あるいは $-A^5-R_e$ であり、 $R_{y'}$ が水素原子、炭素数1~8個のアルキル基、又は $-A^6-Q_p$ であるか、あるいは $R_{z'}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数3~7の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成しており、 $-D-R_{x'}$ 又は $-N(R_{y'})(R_{z'})$ が水酸基を含む場合には、その水酸基は $R_{p^1}$ で保護されていてもよく、 $-D-R_{x'}$ 又は $-N(R_{y'})(R_{z'})$ がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は $R_{p^2}$ で保護されていてもよい上記(129)から(135)のいずれかに記載の化合物。

## 【0159】

(137) 一般式(III)において、 $R_{s'}$ が $-N(R_{y'})(R_{z'})$ である上記(129)から(136)のいずれかに記載の化合物。

## 【0160】

(138) 一般式(III)において、 $R_{s'}$ が $-D-R_{x'}$ であり、 $D$ はイオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は $-C(O)-$ である上記(129)から(136)のいずれかに記載の化合物。

## 【0161】

(139) 一般式(III)において、 $AR'$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{2'}$ の位置に

結合しており、 $R_{s'}$  が  $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は  $C^{5'}$  のうちの何れか一つの環構成炭素原子に結合している上記 (129) に記載の化合物。

【0162】

(140) 一般式 (III) において、 $AR'$  が  $C^{2'}$  に結合しており、 $R_{s'}$  が  $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は  $C^{5'}$  の何れかの原子に結合しており、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は  $C^{5'}$  のうち  $R_{s'}$  が結合していない環構成炭素原子は  $V'$  で置き換えられていてもよく、 $V'$  が窒素原子又は  $Z_{x'}$  で置換された炭素原子であり、 $Z_{x'}$  がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基からなる群から選ばれる1種の基であり、ただし  $Z_{x'}$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R_{p^1}$  で保護されていてもよく、 $Z_{x'}$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $R_{p^2}$  で保護されていてもよく、

$R_{s'}$  が  $-D-R_{x'}$  又は  $-N(R_{y'})(R_{z'})$  であり、 $D$  が酸素原子又はイオウ原子であり、 $R_{x'}$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいは  $R_b$  又は  $R_c$  であり、 $R_b$  中の  $Q$  がフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$  が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  であり (ただし  $A^2$  が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  であるときには  $A^1$  がエチレンである)、 $R^2$  及び  $R^3$  はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり

(ただし  $Q$  がフェニル基であり、 $A^1$  が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ  $A^2$  が単結合であるときには、 $R^2$  又は  $R^3$  のどちらか一方は水素原子以外の置換基である)。  $R_c$  中の  $p$  が整数2又は3であり、 $A^4$  が単結合又はメチレンであり、 $A^5$  が  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は  $-S(O)_2-$  であり、 $R_d$  が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $R_e$  がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ

基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基であり、R<sup>2'</sup>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2,3-ジメチルフェニルメチル基、3,5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2,3-ジフルオロフェニルメチル基、2,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,5-ジフルオロフェニルメチル基、3,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,3-ジクロロフェニルメチル基、2,4-ジクロロフェニルメチル基、2,5-ジクロロフェニルメチル基、2,6-ジクロロフェニルメチル基、3,4-ジクロロフェニルメチル基、3,5-ジクロロフェニルメチル基、3,6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N,N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル

基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基でありR<sub>y</sub>'は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>'と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基又はピラゾール-1-イル基を形成しており、ただし-D-R<sub>x</sub>'又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>')が水酸基を含む場合、その水酸基はR<sup>1</sup>pで保護されていてもよく、-D-R<sub>x</sub>'又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>')がアミノ基を含む場合、そのアミノ基はR<sup>2</sup>pで保護されていてもよく、AR'がナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル

基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい）であり、X<sub>a</sub>がオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、ただしAR'が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい上記



(129)に記載の化合物。

【0163】

(141) 一般式(III)において、 $R_{s'}$  が $-O-R_{x'}$ であり、芳香環( $E'$ )において $C^{2'}$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 及び $C^{6'}$ がいずれも $V'$ で置き換えられていない上記(139)又は(140)のいずれかに記載の化合物。

【0164】

(142) 一般式(III)において、 $AR'$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{2'}$ の位置に結合しており、 $R_{s'}$ が $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は $C^{5'}$ のうちの何れか一つの環構成炭素原子に結合しており、 $R_{s'}$ が $-O-R_{x'}$ であり、芳香環( $E'$ )において $C^{2'}$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 及び $C^{6'}$ がいずれも $V'$ で置き換えられていない上記(131)に記載の化合物。

【0165】

(143) 一般式(III)において、 $AR'$ が芳香環( $E'$ )上の $C^{2'}$ の位置に結合しており、 $R_{s'}$ が $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は $C^{5'}$ のうちの何れか一つの環構成炭素原子に結合しており、 $R_{s'}$ が $-O-R_{x'}$ であり、芳香環( $E'$ )において $C^{2'}$ 、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 及び $C^{6'}$ がいずれも $V'$ で置き換えられていない上記(132)に記載の化合物。

【0166】

(144) 一般式(III)において、 $R_{s'}$ が $C^{3'}$ に結合している上記(139)から(143)のいずれかに記載の化合物。

【0167】

(145) 一般式(III)において、 $C^{2'}$ が $AR'$ で結合された炭素原子であり、 $C^{3'}$ が $R_{s'}$ で結合された炭素原子であり、 $C^{4'}$ が $V'$ で置き換えられていてもよく、 $C^{5'}$ 及び $C^{6'}$ が無置換の環構成炭素原子であり、 $V'$ が窒素原子であるか、あるいは $Z_{x'}$ で置換された炭素原子であり、 $Z_{x'}$ がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基であり、ただし $Z_{x'}$ が水酸基を含む場合には、その水酸基は $R_{p^1}$ で保護されていてもよく、 $Z_{x'}$ がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は $R_{p^2}$ で保護されていてもよく、

$R_{s'}$ が $-O-R_{x'}$ であり、 $R_{x'}$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2,3-ジメチルフェニルメチル基、3,5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2,3-ジフルオロフェニルメチル基、2,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,5-ジフルオロフェニルメチル基、3,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,

3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-

イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよい）であり、ただしAR'が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい（129）に記載の化合物。

# 【0168】

（146）一般式（III）において、R<sup>s'</sup>がC<sup>4'</sup>に結合している上記（139）から（143）のいずれかに記載の化合物。

# 【0169】

（147）一般式（III）において、C<sup>2'</sup>がAR'で結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がR<sup>s'</sup>で結合された炭素原子であり、C<sup>5'</sup>がV'で置き換えられていてもよく、C<sup>3'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、V'が窒素原子であるか、あるいはZ<sup>x'</sup>で置換された炭素原子であり、Z<sup>x'</sup>がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基であり、ただしZ<sup>x'</sup>が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、Z<sup>x'</sup>がアミノ基を含む場合、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよく、R<sup>s'</sup>が-O-R<sup>x'</sup>であり、R<sup>x'</sup>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-

メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N,N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基で

あり、ただし  $AR'$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R_p^1$  で保護されていてもよく、また、 $AR'$  がアミノ基を含む場合、そのアミノ基は  $R_p^2$  で保護されていてもよい  
上記 (129) に記載の化合物。

【0170】

(148) 一般式 (III) において、 $Rs'$  が  $C^5'$  に結合している上記 (139) から (143) のいずれかに記載の化合物。

【0171】

(149) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^3'$  に結合しており、 $Rs'$  は芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^5'$  又は  $C^6'$  のうちの何れかの原子に結合している上記 (129) に記載の化合物。

【0172】

(150) 一般式 (III) において、 $Rs'$  が  $-O-R_x'$  であり、芳香環 ( $E'$ ) において  $C^2'$ 、 $C^3'$ 、 $C^4'$ 、 $C^5'$  及び  $C^6'$  がいずれも  $V'$  で置き換えられていない上記 (149) に記載の化合物。

【0173】

(151) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^3'$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^5'$  又は  $C^6'$  のうちの何れかの原子に結合しており、 $Rs'$  が  $-O-R_x'$  であり、芳香環 ( $E'$ ) において  $C^2'$ 、 $C^3'$ 、 $C^4'$ 、 $C^5'$  及び  $C^6'$  がいずれも  $V'$  で置き換えられていない上記 (131) に記載の化合物。

【0174】

(152) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^3'$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^5'$  又は  $C^6'$  のうちの何れかの原子に結合しており、 $Rs'$  が  $-O-R_x'$  であり、芳香環 ( $E'$ ) において  $C^2'$ 、 $C^3'$ 、 $C^4'$ 、 $C^5'$  及び  $C^6'$  がいずれも  $V'$  で置き換えられていない上記 (132) に記載の化合物。

【0175】

(153) 一般式 (III) において、 $Rs'$  が  $C^5'$  に結合している上記 (149) から (152) のいずれかに記載の化合物。

【0176】

(154) 一般式 (III) において、 $C^3'$  が  $AR'$  で結合された炭素原子であり、 $C^5'$  が  $Rs'$  で結合された炭素原子であり、 $C^2'$ 、 $C^4'$ 、及び  $C^6'$  は無置換の環構成炭素原子であり、

$Rs'$  が  $-O-R_x'$  であり、 $R_x'$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニル

ルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1

—(2-ヒドロキシエチル)—1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、ただしAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、AR' がアミノ基を含む場合、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい上記(129)に記載の化合物。

## 【0177】

(155) 一般式(III)において、Rs' がC<sup>6'</sup> に結合している上記(149)から(152)のいずれかに記載の化合物。

## 【0178】

(156) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>6'</sup>がV'である上記(129)に記載の化合物。

## 【0179】

(157) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>6'</sup>がZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>5'</sup>が無置換の炭素原子であり、Rs' が—O—R<sub>x'</sub>である上記(131)に記載の化合物。

## 【0180】

(158) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>6'</sup>がZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>5'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が—O—R<sub>x'</sub>である上記(132)に記載の化合物。

## 【0181】

(159) 一般式(III)において、C<sup>3'</sup>がAR'で結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がRs'で結合された炭素原子であり、C<sup>6'</sup>がZ<sub>x'</sub>で置換された炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>5'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Z<sub>x'</sub>がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基であり、ただしZ<sub>x'</sub>が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、Z<sub>x'</sub>がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよく、

Rs' が—O—R<sub>x'</sub>であり、R<sub>x'</sub>がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロ

フェニル) エチル基、1-(4-フルオロフェニル) エチル基、1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、1-(4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、2-(4-メチルフェニル) エチル基、2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-



2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、ただしAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい上記(129)に記載の化合物。

#### 【0182】

(160) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>が窒素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-O-R<sub>x</sub>'である上記(129)に記載の化合物。

#### 【0183】

(161) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>が窒素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-O-R<sub>x</sub>'である上記(131)に記載の化合物。

#### 【0184】

(162) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>が窒素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-O-R<sub>x</sub>'である上記(132)に記載の化合物。

#### 【0185】

(163) 一般式(III)において、C<sup>3'</sup>がAR'で結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がRs'で結合された炭素原子であり、C<sup>5'</sup>が窒素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、

Rs' が-O-R<sub>x</sub>'であり、R<sub>x</sub>'がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロ

フェニル) エチル基、1-(4-フルオロフェニル) エチル基、1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、1-(4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、2-(4-メチルフェニル) エチル基、2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-

2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンキノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、ただしAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい上記(129)に記載の化合物。

## 【0186】

(164) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-D-Rx'であり、Dが単結合、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-である上記(129)に記載の化合物。

## 【0187】

(165) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>は無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-D-Rx'であり、Dが単結合、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-である上記(131)に記載の化合物。

## 【0188】

(166) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' は芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-D-Rx'であり、Dが単結合、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-C(O)-である上記(132)に記載の化合物。

## 【0189】

(167) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-N(Ry')(Rz')である上記(129)に記載の化合物。

## 【0190】

(168) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-N(Ry')(Rz')である上記(131)に記載の化合物。

## 【0191】

(169) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であ

り、 $R_{s'}$  が  $-N(R_{y'}) (R_{z'})$  である上記(132)に記載の化合物。

【0192】

(170) 一般式(III)において、 $AR'$  が芳香環( $E'$ )上の $C^{3'}$ に結合しており、 $R_{s'}$  が芳香環( $E'$ )上の $C^{4'}$ に結合しており、 $C^5$ が  $-N(R_{n^1}) (R_{n^2})$  で置換された炭素原子であり(ただし $R_{n^1}$ 又は $R_{n^2}$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、 $C^{2'}$  及び $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$  が  $-O-R_x$  である上記(129)に記載の化合物。

【0193】

(171) 一般式(III)において、 $AR'$  が芳香環( $E'$ )上の $C^{3'}$ に結合しており、 $R_{s'}$  が芳香環( $E'$ )上の $C^{4'}$ に結合しており、 $C^{5'}$  が  $-N(R_{n^1}) (R_{n^2})$  で置換された炭素原子であり(ただし $R_{n^1}$ 又は $R_{n^2}$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、 $C^{2'}$  及び $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$  が  $-O-R_{x'}$  である上記(131)に記載の化合物。

【0194】

(172) 一般式(III)において、 $AR'$  が芳香環( $E'$ )上の $C^{3'}$ に結合しており、 $R_{s'}$  が芳香環( $E'$ )上の $C^{4'}$ に結合しており、 $C^{5'}$  が  $-N(R_{n^1}) (R_{n^2})$  で置換された炭素原子であり(ただし $R_{n^1}$ 又は $R_{n^2}$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、 $C^{2'}$  及び $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $R_{s'}$  が  $-O-R_{x'}$  である上記(123)に記載の化合物。

【0195】

(173) 一般式(III)において、 $C^{3'}$  が  $AR'$  で結合された炭素原子であり、 $C^{4'}$  が  $R_{s'}$  で結合された炭素原子であり、 $C^{5'}$  が  $Z_{x'}$  で置換された炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び $C^{6'}$  は無置換の環構成炭素原子であり、 $Z_{x'}$  が  $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は $N$ ,  $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基であり、ただし $Z_{x'}$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は $R_{p^2}$ で保護されていてもよく、

$R_{s'}$  が  $-O-R_{x'}$  であり、 $R_{x'}$  がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロ

フェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1

, 2-a] ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b] ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b] ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b] ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b] ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b] ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、ただしAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい上記(129)に記載の化合物。

## 【0196】

(174) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-D-Rx'であり、Rx'がRcと同義であり、ただしRcが水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、Rcがアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい上記(129)に記載の化合物。

## 【0197】

(175) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-D-Rx'であり、Rx'がRcと同義であり、ただしRcが水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、Rcがアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい上記(131)に記載の化合物。

。

## 【0198】

(176) 一般式(III)において、AR' が芳香環(E')上のC<sup>3'</sup>に結合しており、Rs' が芳香環(E')上のC<sup>4'</sup>に結合しており、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Rs' が-D-Rx'であり、Rx'がRcと同義であり、ただしRcが水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、Rcがアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい上記(132)に記載の化合物。

## 【0199】

(177) 一般式(III)において、C<sup>3'</sup>がAR'で結合された炭素原子であり、C<sup>4'</sup>がRs'で結合された炭素原子であり、C<sup>5'</sup>がZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>が無置換の環構成炭素原子であり、Zx'がフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基であり、ただしZx'が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、Zx'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよく、

Rs' が-O-Rx'であり、Rx'がRcと同義であり、ただしRcが水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、Rc中のpが整数2であり、A<sup>4</sup>が単結合又はメチレンであり、A<sup>5</sup>が-C(O)-、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-であり、Rdがメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、又は4-フルオロフェニルメチル基であり、Reがイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロ

プロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基であり、

AR' がナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基であり、ただしAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい上

記(129)に記載の化合物。

【0200】

(178) 一般式(III)において、 $AR'$ が $C^{3'}$ に結合しており、 $Rs'$ が $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、又は $C^{6'}$ の何れかの原子に結合しており、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、又は $C^{6'}$ のうち $Rs'$ が結合していない環構成炭素原子は $V'$ で置き換えられていてもよく、

$V'$ が窒素原子であるか、あるいは $Zx'$ で置換された炭素原子であり、 $Zx'$ がフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基であり、ただし $Zx'$ が水酸基を含む場合には、その水酸基は $Rp^1$ で保護されていてもよく、 $Zx'$ がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は $Rp^2$ で保護されていてもよく、

$Rs'$ が $-D-Rx'$ 又は $-N(Ry')(Rz')$ であり、 $D$ が酸素原子又はイオウ原子であり、 $Rx'$ がブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基であるか、あるいは $Rb$ 又は $Rc$ であり、 $Rb$ 中の $Q$ がフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基であり、 $A^2$ が単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であり(ただし $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-であるとき $A^1$ がエチレンである)、 $R^2$ 及び $R^3$ がそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基であり(ただし $Q$ がフェニル基であり、 $A^1$ が単結合又は無置換のメチレンであり、かつ $A^2$ が単結合であるときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方が水素原子以外の置換基である)、 $Rc$ 中の $p$ が整数2又は3であり、 $A^4$ が単結合又はメチレンであり、 $A^5$ が $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ であり、 $Rd$ が水素原子であるか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ペンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基であり、 $Re$ がメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-フルオロフェニル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(



ピリジン-3-イル) アミノ基、N-(ピリジン-4-イル) アミノ基、N-(フラン-2-イル) アミノ基、N-(フラン-3-イル) アミノ基、N-(チオフェン-2-イル) アミノ基、N-(チオフェン-3-イル) アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基又はエチルオキシカルボニルアミノ基でありR<sub>2</sub>'はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチ

オカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基でありR<sub>y</sub>'は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基であるか、あるいはR<sub>z</sub>'と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロールー1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基であり、ただし-D-R<sub>x</sub>'又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>')が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換基-D-R<sub>x</sub>'又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>')がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよく、

AR'がナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル

基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい）であり、X<sub>a</sub>がオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N-ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基であり、ただしAR'が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、AR'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい上記

(129) に記載の化合物。

【0201】

(179) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  が  $Zx'$  で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs'$  が  $-O-Rx'$  である上記 (119) に記載の化合物。

【0202】

(180) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  が  $Zx$  で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $D$  が酸素原子である上記 (131) に記載の化合物。

【0203】

(181) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  が  $Zx'$  で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs'$  が  $-O-Rx'$  である上記 (132) に記載の化合物。

【0204】

(182) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  がニトロ基で置換された炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs'$  が  $-O-Rx'$  である上記 (129) に記載の化合物。

【0205】

(183) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  がニトロ基で置換された炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs'$  が  $-O-Rx'$  である上記 (131) に記載の化合物。

【0206】

(184) 一般式 (III) において、 $AR'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  が芳香環 ( $E'$ ) 上の  $C^{4'}$  に結合しており、 $C^{5'}$  がニトロ基で置換された炭素原子であり、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  が無置換の環構成炭素原子であり、 $Rs'$  が  $-O-Rx'$  である上記 (132) に記載の化合物。

【0207】

(185) 4型  $PLA_2$  阻害剤を有効成分とする線維症の予防及び／又は治療剤。

【0208】

(186) 4型  $PLA_2$  阻害剤を有効成分とする肺線維症の予防及び／又は治療剤。

【0209】

(187) 肺線維症が、薬剤誘起性肺線維症である上記 (186) に記載の予防及び／又は治療剤。

【0210】

(188) 薬剤誘起性肺線維症が、メトトレキサート、金チオリンゴ酸ナトリウム、オーラノフィン、D-ペニシラミン、プシラミン、アクタリット、サラゾスルファピリジン、シクロフォスファミド、タキソール、エトポシド、シスプラチン、ビンクリスチン、ビンブラスチン、イリノテカン、ゲフィチニブ、又はプレオマイシンの何れか1種又は2種以上の薬剤により誘起された疾患である上記 (187) に記載の予防及び／又は治療剤。

【0211】

(189) 薬剤誘起性肺線維症が、メトトレキサート又はプレオマイシンの何れか1種又は両者の薬剤により誘起された疾患である上記 (187) に記載の予防及び／又は治療剤。

【0212】

(190) 4型PLA<sub>2</sub>阻害剤が、式(I)で表される化合物又はその薬理学上許容される塩である上記(186)に記載の予防及び/又は治療剤。

【0213】

(191) 4型PLA<sub>2</sub>阻害剤が、4-(1-ベンズヒドリル-6-クロロ-1H-インドール-3-イルメチル)-3-メトキシ安息香酸、4-{4-[2-(2-[ビス(4-クロロフェニル)メトキシ]エチルスルホニル)エトキシ]フェニル}-1,1,1-トリフルオロ-2-ブタノン、N-{1-[2-(2,4-ジフルオロベンゾイル)ベンゾイル]-4-トリチルスルファニルピロリジン-2-イルメチル}-4-(2,4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)安息香酸アミド、4-メチル-2-オキソ-5-(5,6,7,8-テトラヒドロナフタレン-2-イル)オキサゾリジン-3-カルボン酸(6-メトキシテトラヒドロピラン-2-イル)アミド、4-メチル-2-オキソ-5-(4-メチルフェニル)チアゾリジン-3-カルボン酸(テトラヒドロピラン-2-イル)アミド、4-[3-(4-デシルオキシフェニルオキシ)-2-オキソプロピルオキシ]安息香酸、及び1-{2-[4-(カルボキシメチル)フェノキシ]エチル}-3-ドデカノイルインドール-2-カルボン酸からなる群から選ばれる阻害剤又はその薬理学上許容される塩である上記(186)に記載の予防及び/又は治療剤。

【発明の効果】

【0214】

本発明化合物(I)又は薬理学的に許容されるその塩は、プロスタグランジン及びロイコトリエンの両者の産生に対して抑制作用を有し、人や動物に投与した場合、プロスタグランジン及び/又はロイコトリエンが関与する疾患、病態に対して優れた予防及び/又は治療効果を示し、しかも毒性が著しく低いという特徴を有する。本発明化合物(II)及び(III)は、本発明化合物(I)を製造するために有用な中間体である。また、4型PLA<sub>2</sub>阻害剤は、線維症、特に肺線維症、とりわけ薬剤の副作用として誘起される薬剤誘起性肺線維症の予防及び/又は治療剤として有用であることが確認された。

【発明を実施するための最良の形態】

【0215】

本明細書において、炭素原子を単に“C”で、水素原子を“H”で、酸素原子を“O”で、イオウ原子を“S”で、また窒素原子を“N”で示すことがある。

前記一般式(I)におけるnは1~3の何れかの整数である。nが1、2又は3において極めて特徴的に所望の作用が発現される。nが1のメチレン、2のエチレン又は3のトリメチレンが好ましく、2のエチレンは特に好ましい。

【0216】

前記一般式(I)における芳香環(E)上のC<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>及びC<sup>6</sup>はそれぞれ環構成炭素原子を示す。環構成炭素原子は、芳香環(E)を形成することからC又はCHのいずれかで表される。それらのうちでR<sub>s</sub>又はARが結合されていない何れか一つの環構成炭素原子はVで置き換えられていてもよい。上記の「置き換え」とは、C<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>及びC<sup>6</sup>のうちの1個の環構成炭素原子がVで入れ替わり、Vが環構成要素となることである。R<sub>s</sub>及びARはそれぞれ芳香環(E)上のC<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>又はC<sup>6</sup>の何れかの環構成炭素原子に結合するが、これは例えば、ARがC<sup>2</sup>に結合している場合、R<sub>s</sub>がC<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>又はC<sup>6</sup>の何れかの環構成炭素原子と結合しており、また、ARがC<sup>3</sup>に結合している場合には、R<sub>s</sub>はC<sup>2</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>又はC<sup>6</sup>の何れかの環構成炭素原子と結合しており、さらにARがC<sup>4</sup>に結合している場合には、R<sub>s</sub>がC<sup>2</sup>又はC<sup>3</sup>の何れかの環構成炭素原子と結合していることを意味する。これら置換位置の組み合わせのうち、ARがC<sup>2</sup>に結合しており、かつR<sub>s</sub>がC<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、又はC<sup>5</sup>の何れかの原子と結合している場合が好ましい例として挙げられ、ARがC<sup>2</sup>に結合しており、かつR<sub>s</sub>がC<sup>3</sup>又はC<sup>4</sup>に結合している場合が特に好ましい例として挙げられる。また、ARがC<sup>3</sup>に結合しており、かつR<sub>s</sub>がC<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、又はC<sup>6</sup>の何れかの原子と結合している場合が好ましい例として挙げられ、ARがC<sup>3</sup>に結合しており、かつR<sub>s</sub>がC<sup>4</sup>又はC<sup>5</sup>の何れかの原子と結合している場合が特に好ましい例として挙げられる。ARがC<sup>3</sup>に結合しており、かつR<sub>s</sub>がC<sup>4</sup>と結合し

ている場合は非常に好ましい一例である。

#### 【0217】

$C^2$ 、 $C^3$ 、 $C^4$ 、 $C^5$ 又は $C^6$ のうちRs及びARが結合されていない何れか一つの原子はVで置き換えられていてもよい。例えば、ARが $C^2$ に結合しており、かつRsが $C^3$ に結合している場合、 $C^4$ 、 $C^5$ 、又は $C^6$ のうち何れかの一つの環構成炭素原子はVで置き換えられていてもよい。また、別の例を挙げると、ARが $C^3$ に結合しており、かつRsが $C^4$ に結合している場合、 $C^2$ 、 $C^5$ 、又は $C^6$ のうち何れかの一つの原子がVで置き換えられていてもよいことを意味する。これら又は他の組み合わせのうち、ARが $C^2$ に結合しており、Rsが $C^3$ に結合しており、 $C^4$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^2$ に結合しており、Rsが $C^4$ に結合しており、 $C^5$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^2$ に結合しており、Rsが $C^5$ に結合しており、 $C^4$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^4$ に結合しており、 $C^5$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^5$ に結合しており、 $C^4$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^4$ に結合しており、 $C^6$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^5$ に結合しており、 $C^4$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^6$ に結合しており、 $C^5$ がVで置き換えられている場合などが好ましい例として挙げられる。また、ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^4$ に結合しており、 $C^5$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^5$ に結合しており、 $C^4$ がVで置き換えられている場合；ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^6$ に結合しており、 $C^5$ がVで置き換えられている場合などが好ましい例として挙げられ、さらに、ARが $C^3$ に結合しており、Rsが $C^4$ に結合しており、 $C^5$ がVで置き換えられている場合は非常に好ましい一例である。

#### 【0218】

Vは、窒素原子を表すか、あるいはZxで置換された炭素原子を表す。すなわちVが窒素原子を示すとき、前記一般式(I)における芳香環(E)はピリジン環を表す。またVがZxで置換された炭素原子を示すとき、芳香環(E)はZxを有するベンゼン環を表す。これらはいずれも特に好ましい例として挙げられる。さらにARは $C^3$ に結合しており、Rsは $C^4$ に結合しており、 $C^5$ はVで置換され、このVが窒素原子を示す場合は非常に好ましい一例である。

Zxは、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、 $-OR^9$ 、又は $-N(R^{n1})(R^{n2})$ として定義される。これらのうちフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基は好ましい例として挙げられ、フッ素原子は特に好ましい例として挙げられる。

Zxのうち炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基とはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt-ブチル基等が挙げられ、これらのうちメチル基は特に好ましい例である。

#### 【0219】

$R^9$ は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、又は $-A^6-Qp$ を表す。このうち水素原子は特に好ましい例として挙げられる。炭素数1～4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt-ブチル基等が挙げられ、メチル基は特に好ましい例である。

$-A^6-Qp$ の $A^6$ は単結合又はメチレンを表し、Qpは1個又は同一若しくは異なる2個以上の $T^1$ で置換されていてもよいフェニル基を表す。置換基 $T^1$ は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、水酸基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、ニトロ基、炭素数1～4個のアルコキシ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。 $-A^6-Qp$ の具体的な例としては、フェニル基、メチルフェニル基、クロロフェニル基、ベンジル基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N-メチルアミノベンジル基、N,N-ジメチルアミノベンジル基等が挙げられる。

$-OR^9$ のうち好ましい例としては水酸基、メトキシ基等が挙げられ、水酸基は特に好ましい一例である。

## 【0220】

$Rn^1$ は水素原子又は炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基を表し、水素原子は特に好ましい例として挙げられる。炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又は $t$ -ブチル基等が挙げられ、このうちメチル基、エチル基、プロピル基、又はイソプロピル基等は好ましい例として挙げられ、メチル基は特に好ましい例である。

$Rn^2$ は $Rn^1$ と同義であるか、あるいは $-COR^{23}$ 基又は $-SO_2R^{24}$ 基を表すか、 $Rn^1$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。

## 【0221】

$R^{23}$ は水素原子、炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数1～4個の低級アルコキシ基、 $-O-A^6-Qp$ 、又は $-N(R^{25})(R^{26})$ を表す。 $R^{25}$ は水素原子、炭素数1～4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基を表す。 $R^{26}$ は $R^{25}$ と同義であるか、あるいは $R^{25}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を示す。「 $R^{25}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する」場合としては、例えば、ピロリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基などの窒素原子を含む環状アミノアルキル基が形成される場合を挙げることができる。

## 【0222】

$-COR^{23}$ の具体的な例としては、ホルミル基、アセチル基、 $t$ -ブチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルバモイル基、 $N$ -メチルカルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルカルバモイル基、ピペリジン-1-カルボニル基、モルホリン-4-カルボニル基などが挙げられ、好ましい例としてホルミル基、アセチル基、カルバモイル基などが挙げられる。なお、上記の各発明において、例えば、 $A^6$ や $Qp$ に代表されるとおり、異なる部分に同一の記号を用いている場合がある。これらの記号は同一の置換基の群を示すが、それぞれ置換基は独立したものであることから、常に同一の置換基が選択されなければならないことを意味せず、結果的に同一、または異なる種類の置換基が選択されることを妨げるものではない。

## 【0223】

$R^{24}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。 $-SO_2R^{24}$ の具体的な例としては、メシル基、スルファモイル基、 $N$ -メチルスルファモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイル基などが挙げられ、好ましい例としてメシル基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイル基などが挙げられる。

## 【0224】

$-N(Rn^1)(Rn^2)$ の具体例としては、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジノ基、モルホリノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、 $t$ -ブチルオキシカルボニルアミノ基、フェニルオキシカルボニルアミノ基、ベンジルオキシカルボニルアミノ基、カルバモイルアミノ基、 $N$ -メチルカルバモイルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルカルバモイルアミノ基、ピペリジン-1-カルボニルアミノ基、モルホリン-4-カルボニルアミノ基、メシルアミノ基、スルファモイルアミノ基、 $N$ -メチルスルファモイルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基などが挙げられ、このうち好ましい例としてはアミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基などが挙げられ、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基は特に好ましい例として挙げられる。

## 【0225】

従って、 $Z_x$ として好ましい例はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基などが挙げられ、特に好ましい例としてフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基などが挙げられる。

前記一般式 (I) における  $R_s$  は  $-D-R_x$  あるいは  $-N(R_y)(R_z)$  を示すものと定義される。

$D$  は、単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、又は  $-C(O)-$  を表すものとして定義される。これらのうち酸素原子及びイオウ原子は好ましい例であり、酸素原子は特に好ましい例である。

#### 【0226】

$R_x$  は、炭素数 3～8 個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基、あるいは先に示した  $R_a$ 、 $R_b$  又は  $R_c$  を示す。

$R_x$  のうち炭素数 3～8 個の直鎖状又は分枝状の飽和アルキル基としては、例えば、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、1-メチルプロピル基、 $t$ -ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2-メチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4-メチルペンチル基、2, 3-ジメチルブチル基、2-エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基等が挙げられるが、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基が特に好ましい。

$R_x$  のうち、 $R_a$  の  $R^1$  は炭素数 1～4 の低級アルキル基で置換されているか、あるいは無置換の炭素数 3～7 個の環状飽和アルキル基又は炭素数 6～8 個の縮合環状飽和アルキル基として定義される。 $R^1$  のうち炭素数 3～7 個の環状飽和アルキル基としてはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基等が挙げられるが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基は特に好ましい。また  $R^1$  のうち炭素数 6～8 個の縮合環状飽和アルキル基としてはビスシクロ [2, 2, 1] ヘプチル基、ビスシクロ [2, 2, 2] オクチル基などが挙げられる。

#### 【0227】

$R^1$  に置換する炭素数 1～4 の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基等が挙げられる。炭素数 1～4 の低級アルキル基が置換した  $R^1$  の例としてはメチルシクロペンチル基、メチルシクロヘキシル基、メチルビスシクロ [2, 2, 1] ヘプチル基などが挙げられる。

$k$  は 0 又は 1～3 のいずれの整数として定義されるが、0 の結合又は 1 のメチレン、2 のエチレンは好ましく、0 の結合又は 1 のメチレンは特に好ましい。

#### 【0228】

$R_a$  の例としてはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、3, 4-ジメチルシクロペンチル基、4-メチルシクロヘキシル基、4, 4-ジメチルシクロヘキシル基、4-エチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシルメチル基、ビスシクロ [2, 2, 1] ヘプタン-2-メチル基、ビスシクロ [2, 2, 2] オクタン-2-メチル基、3-メチルビスシクロ [2, 2, 1] ヘプタン-2-メチル基、ビスシクロ [2, 2, 1] ヘプト-1-イルメチル基、ビスシクロ [2, 2, 2] オクト-1-メチル基などが挙げられるが、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基は好ましく、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基は特に好ましい。



## 【0229】

R<sub>x</sub>のうち、R<sub>b</sub>のA<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-、又は-N(R<sup>4</sup>)-と定義される。R<sup>4</sup>は炭素数1~4個の低級アルキル基と定義され、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基等が挙げられるが、メチル基、エチル基は特に好ましい例である。従って、A<sup>2</sup>のうち特に好ましい例は単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、-N(エチル)-が挙げられる。

## 【0230】

A<sup>1</sup>は単結合又は炭素数1~3個のアルキレン(a)すなわちメチレン、エチレンあるいはトリメチレンとして定義される。但しA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-又は-N(R<sup>4</sup>)-を示すときA<sup>1</sup>はエチレン又はトリメチレンの何れかである。またアルキレン(a)は炭素数1~4個の低級アルキル基又はフェニル基で置換される場合も含まれる。このときの炭素数1~4個の低級アルキル基とはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基等が挙げられるがメチル基、エチル基は好ましい例である。A<sup>1</sup>の具体的な例としてメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、フェニルメチレン、エチレン、メチルエチレン、ジメチルエチレン、エチルエチレン、フェニルエチレン、トリメチレン、メチルトリメチレンなどが挙げられる。このうちA<sup>2</sup>が単結合を示すときには、A<sup>1</sup>は単結合であるか、あるいはメチレン、メチルメチレン、又はエチレンであることが特に好ましい。またA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-S(O)-、-S(O)<sub>2</sub>-又は-N(R<sup>4</sup>)-を示すときには、A<sup>1</sup>がエチレンであることが特に好ましい。

## 【0231】

R<sub>b</sub>のQは、部分的不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環(q)の残基と定義され、複素環(q)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれる同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1~4個含む環を意味する。「残基」とは、環構成原子に結合する水素原子を除くことにより形成される一価の基のことである。単環式の炭素環又は複素環の残基としては原子数5~7個の部分的飽和又は完全不飽和である置換基を示し、例えばフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基などが挙げられる。これらのうちフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基は好ましい例であり、フェニル基は特に好ましい例である。

## 【0232】

縮合二環式の炭素環あるいは複素環としては原子数8~11個の部分不飽和又は完全不飽和である環を示し、その残基としては、例えばナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基、4H-クロメニル基、ジヒドロベンゾジオキシル基、ベンゾイソオキサゾリル基、ピロロピリジニル基、ピラゾロピリジニル基、トリアゾロピリジニル基、チエノピリジニル基、チエノピラゾリル基、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール基などが挙げられる。これらのうちナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、ジヒドロベンゾジオキシル基は好ましい例として挙げられ、インダニル基は特に好ましい例の一つである。

## 【0233】

Qは環上の任意の位置でA<sup>2</sup>と結合する。結合位置を表したQの好ましい例としてはフェニル基、2-又は3-チエニル基、2-又は3-フリル基、2-、3-又は4-ピリジル基、2-、4-又は5-オキサゾリル基、1-又は2-ナフチル基、1-、2-、5-又は6-テトラヒドロナフチル基、インダン-1-イル基、インダン-2-イル基、インダン-4-イル基、インダン-5-イル基、1-、2-、3-、4-、5-、6-又は7-インドリル基、2

一、あるいは5-又は6-ジヒドロベンゾジオキシル基等が挙げられ、これらのうちフェニル基、インダン-2-イル基は非常に好ましい一例である。

#### 【0234】

R<sup>b</sup>中、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はQの置換基であり、それぞれ独立に水素原子、炭素数1~4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、オキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、トリフルオロメチル基、-OR<sup>5</sup>、-N(R<sup>6</sup>)(R<sup>6'</sup>)、-NHCOR<sup>7</sup>、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>、-A<sup>6</sup>-Qaを表すか、あるいはこれらは互いに繋がってメチレンジオキシル基を示すものと定義される。

炭素数1~4個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基等が挙げられるがメチル基は特に好ましい例である。

#### 【0235】

-N(R<sup>6</sup>)(R<sup>6'</sup>)のR<sup>6</sup>は水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基を示す。R<sup>6'</sup>はR<sup>6</sup>と同義であるか、あるいはR<sup>6</sup>と繋がってこれらが結合する窒素原子とともに3~6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成しているものである。従って、-N(R<sup>6</sup>)(R<sup>6'</sup>)の具体例としてはアミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジノ基、モルホリノ基などが挙げられ、N,N-ジメチルアミノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基などは好ましい例であり、N,N-ジメチルアミノ基は特に好ましい例である。

R<sup>5</sup>及びR<sup>7</sup>それぞれ独立に水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基又は-A<sup>6</sup>-Qa基と定義される。炭素数1~4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基等が挙げられ、このうちメチル基は好ましい例である。

#### 【0236】

-A<sup>6</sup>-QaのA<sup>6</sup>は前述と同義である。Qaは部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環(qa)と定義され、複素環(qa)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一又は異なる環構成ヘテロ原子を1~4個含む置換基を意味する。単環式の炭素環あるいは複素環としては原子数5~7個の部分不飽和又は完全不飽和の環であり、その残基としては、例えばフェニル基、チエニル基、フリル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基などが挙げられる。縮合二環式の炭素環あるいは複素環としては原子数8~11個の部分不飽和又は完全不飽和である環を表し、その残基としては、例えばナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基などが挙げられる。

Qaはその環上の任意の位置でA<sup>6</sup>と結合する。さらにQaは1個又は同一若しくは異なる2個以上のT<sup>1</sup>で置換されていてもよい。T<sup>1</sup>は前述と同義である。

#### 【0237】

-A<sup>6</sup>-Qaの具体例としてフェニル基、メチルフェニル基、クロロフェニル基、ベンジル基、メチルベンジル基、クロロベンジル基、ジクロロベンジル基、フルオロベンジル基、トリフルオロメチルベンジル基、ニトロベンジル基、メトキシフェニル基、N-メチルアミノベンジル基、N,N-ジメチルアミノベンジル基、フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、イソオキサゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、ピラゾリル基、オキサジアゾリル基、チアジアゾリル基、トリアゾリル基、テトラゾリル基、ナフチル基、インダニル基、インデニル基、キノリル基、イソキノリル基、インドリル基、ベンゾフリル基、ベンゾチエニル基、ベンズイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、インダゾリル基などが挙げられる。R<sup>8</sup>はそれぞれ炭素数1~4個の低級アルキル基と定義され、炭素数1~4個の低級アル

キル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*t*-ブチル基等が挙げられる。

#### 【0238】

従って、 $R^2$ 及び $R^3$ のうち好ましい例としては水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基が挙げられ、水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基は特に好ましい。またQがフェニル基を示し、 $A^1$ が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつ $A^2$ が単結合を示す場合には、 $R^2$ 又は $R^3$ の少なくともどちらか一方が水素原子以外の置換基を示すことが好ましい。

#### 【0239】

R bのうち特に好ましい例としては、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基などが挙げられる。

#### 【0240】

R cのpは2~4の何れかの整数として定義されるが、pが2の場合のエチレン、3の場合のトリメチレンが好ましく、pが2の場合のエチレンは特に好ましい例である。 $A^4$

は単結合を表すか、あるいはメチレン又はエチレンを表し、単結合あるいはメチレンが特に好ましい例である。 $A^5$ は $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は $-S(O)_2-$ を表し、いずれも好ましい例である。 $R_d$ は水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、又は基Qaを表す。 $R_e$ は炭素数1～8個のアルキル基、 $-A^6-Qa$ 基、 $-(CH_2)_iR^{14}$ 基、 $-OR^{28}$ 基、 $-SR^{28}$ 基、又は $-N(R^{29})(R^{30})$ 基を表す。基Qa及び $-A^6-Qa$ は前述と同様の意味を表す。

#### 【0241】

炭素数1～8個のアルキル基とは、直鎖状若しくは分岐状の飽和アルキル基又は直鎖状若しくは分岐状の部分的に不飽和結合を含むアルキル基、あるいは炭素数3～7のシクロアルキル基を含んでもよいアルキル基を表し、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*t*-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2-メチルブチル基、2, 2-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4-メチルペンチル基、2, 3-ジメチルブチル基、2-エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、3, 4-ジメチルシクロペンチル基、4-メチルシクロヘキシル基、4, 4-ジメチルシクロヘキシル基、4-エチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシルメチル基等が挙げられる。

$-(CH_2)_iR^{14}$ の*i*は1～3の何れかの整数を表し、 $R^{14}$ は水酸基、炭素数1～4個のアルコキシ基、カルボキシ基、又は炭素数1～4個のN, N-ジアルキルカルバモイル基を表す。炭素数1～4個のアルコキシ基としてはメトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブトキシ基、イソブチルオキシ基、又は*t*-ブチルオキシ基などが挙げられる。炭素数1～4個のN, N-ジアルキルカルバモイル基としてはN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基などが挙げられる。 $-OR^{28}$ 又は $-SR^{28}$ の $R^{28}$ は炭素数1～8個のアルキル基又は $-A^6-Qa$ を表すがこれらは前述のものと同義である。

#### 【0242】

$-N(R^{29})(R^{30})$ の $R^{29}$ は炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基、又は $-A^6-Qa$ を表す。これらのうち炭素数1～8個のアルキル基及び $-A^6-Qa$ は前述のものと同義である。炭素数1～4個のアルコキシカルボニル基としてはメチルオキシカルボニル基、エチルオキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、ブチルオキシカルボニル基、イソブチルオキシカルボニル基、又は*t*-ブチルオキシカルボニル基などが挙げられる。 $R^{30}$ は水素原子又は炭素数1～4個の低級アルキル基を表すか、あるいは $R^{29}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。炭素数1～4個の低級アルキル基の意味は前述のものと同義である。「 $R^{29}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する」場合の例としては、例えばピロリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基などの窒素原子を含む環状アミノアルキル基などが挙げられる。

$R_d$ のうち好ましい例としては水素原子若しくはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロベンジル基、4-フルオロベンジル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基などが挙げられる。

また $R_d$ のうち特に好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基

、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、又は4-フルオロフェニルメチル基などが挙げられる。

【0243】

置換-A<sup>4</sup>-R<sup>d</sup>のうち好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソアミル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、2-(シクロプロピル)エチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、2-(シクロペンチル)エチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2-(シクロヘキシル)エチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、(ピリジン-2-イル)メチル基、(ピリジン-3-イル)メチル基、又は(ピリジン-4-イル)メチル基などが挙げられる。

【0244】

また置換-A<sup>4</sup>-R<sup>d</sup>のうち特に好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、ペンチル基、イソアミル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、又は2-(4-フルオロフェニル)エチル基などが挙げられる。

【0245】

R<sup>e</sup>のうち好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*t*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、メチルチオキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-*t*-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基などが挙げられる。

【0246】

またR<sup>e</sup>のうち特に好ましい例としてはイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*t*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロ

ペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基などが挙げられる。

【0247】

-A<sup>5</sup>-R<sup>e</sup>のうち好ましい例としてはアセチル基、チオアセチル基、メタンスルホニル基、プロピオニル基、エチルチオカルボニル基、ブチリル基、プロピルチオカルボニル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、tert-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、フェニルメチルカルボニル基、4-メチルフェニルメチルカルボニル基、4-クロロフェニルメチルカルボニル基、4-フルオロフェニルメチルカルボニル基、(ピリジン-2-イル)カルボニル基、(ピリジン-2-イル)チオカルボニル基、(ピリジン-3-イル)カルボニル基、(ピリジン-4-イル)カルボニル基、(フラン-2-イル)カルボニル基、(チオフェン-2-イル)カルボニル基、メチルオキシカルボニル基、メチルスルファニルカルボニル基、メチルオキシチオカルボニル基、メチルオキシカルボニルアミノカルボニル基、カルバモイル基、N-メチルカルバモイル基、N-メチルチオカルバモイル基、N,N-ジメチルカルバモイル基、N,N-ジメチルチオカルバモイル基、N,N-ジメチルスルファモイル基、エチルオキシカルボニル基、エチルオキシカルボニルアミノカルボニル基、N-エチルカルバモイル基、N-エチルチオカルバモイル基、N,N-ジエチルカルバモイル基、N,N-ジエチルチオカルバモイル基、N,N-ジエチルスルファモイル基、プロピルオキシカルボニル基、N-プロピルカルバモイル基、N-プロピルチオカルバモイル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、tert-ブチルオキシカルボニル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、フェニルメチルオキシカルボニル基、4-メチルフェニルメチルオキシカルボニル基、4-

クロロフェニルメチルオキシカルボニル基、4-フルオロフェニルメチルオキシカルボニル基、N-(ピリジン-2-イル)カルバモイル基、N-(ピリジン-2-イル)チオカルバモイル基、N-(ピリジン-3-イル)カルバモイル基、N-(ピリジン-3-イル)チオカルバモイル基、N-(ピリジン-4-イル)カルバモイル基、N-(ピリジン-4-イル)チオカルバモイル基、N-(フラン-2-イル)カルバモイル基、N-(チオフェン-2-イル)カルバモイル基、(ピロリジノ-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノ-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノ-4-イル)カルボニル基などが挙げられる。

【 0 2 4 8 】

—A<sup>5</sup>—R<sup>e</sup>のうち特に好ましい例としてはイソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、*N*-イソプロピルカルバモイル基、*N*-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、*N*-ブチルカルバモイル基、*N*-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、*N*-イソブチルカルバモイル基、*N*-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、*N*-*t*-ブチルカルバモイル基、*N*-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、*N*-シクロプロピルカルバモイル基、*N*-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、*N*-シクロペンチルカルバモイル基、*N*-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、*N*-シクロヘキシルカルバモイル基、*N*-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、*N*-フェニルカルバモイル基、*N*-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー-4-イル)カルボニル基などが挙げられる。

【 0 2 4 9 】

Rcの具体例としては、2-(N-イソブチリル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-イソブチリル-N-プロピルアミノ)エチル基、2-(N-イソブチリル-N-イソプロピルアミノ)エチル基、2-(N-ブチル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-イソブチル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-シクロプロピル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-シクロペンチル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-シクロペンチルメチル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-シクロヘキシル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-シクロヘキシルメチル-N-イソブチリルアミノ)エチル基、2-(N-イソブチリル-N-フェニルアミノ)エチル基、2-[N-(4-クロロフェニル)-N-イソブチリルアミノ]エチル基、2-[N-(4-フルオロフェニル)-N-イソブチリルアミノ]エチル基、2-(N-ベンジル-N-イソブチリルアミ

ノ) エチル基、2- [N- (4-クロロフェニルメチル) -N-イソブチルアミノ] エチル基、2- [N- (4-フルオロフェニルメチル) -N-イソブチルアミノ] エチル基、2- [N- [2- (4-クロロフェニル) エチル] -N-イソブチルアミノ] エチル基、2- [N- [2- (4-フルオロフェニル) エチル] -N-イソブチルアミノ] エチル基、2- (N-イソブチルチオカルボニル-N-メチルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチルチオカルボニル-N-イソプロピルアミノ) エチル基、2- (N-ブチル-N-イソブチルチオカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチル-N-イソブチルチオカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチル-N-イソブチルチオカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチルメチル-N-イソブチルチオカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチルチオカルボニル-N-フェニルアミノ) エチル基、2- (N-ベンジル-N-イソブチルチオカルボニルアミノ) エチル基、2- [N- (4-フルオロフェニルメチル) -N-イソブチルチオカルボニルアミノ] エチル基、2- (N-メチル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-イソプロピル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-ブチル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-シクロヘキシル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-シクロヘキシルメチル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-フェニル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-ベンジル-N-ピバロイルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチルカルボニル-N-メチルアミノ) エチル基、2- (N-ブチル-N-シクロペンチルカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチルカルボニル-N-イソブチルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチルカルボニル-N-シクロペンチルメチルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチルカルボニル-N-フェニルアミノ) エチル基、2- [N-シクロペンチルカルボニル-N- (4-フルオロフェニル) アミノ] エチル基、2- (N-ベンジル-N-シクロペンチルカルボニルアミノ) エチル基、2- [N-シクロペンチルカルボニル-N- (4-フルオロフェニルメチル) アミノ] エチル基、2- (N-メチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-エチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-フェニルスルホニル-N-プロピルアミノ) エチル基、2- (N-イソプロピル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-ブチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロプロピル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチルメチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロヘキシル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロヘキシルメチル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- (N-フェニル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- [N- (4-フルオロフェニル) -N-フェニルスルホニルアミノ] エチル基、2- (N-ベンジル-N-フェニルスルホニルアミノ) エチル基、2- [N- (N-ブチルカルバモイル) -N-メチルアミノ] エチル基、2- [N-ブチル-N- (N-ブチルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-ブチルカルバモイル) -N-シクロペンチルアミノ] エチル基、2- [N- (N-ブチルカルバモイル) -N-シクロヘキシルメチルアミノ] エチル基、2- [N- (N-ブチルカルバモイル) -N-フェニルアミノ] エチル基、2- {N- (N-ブチルカルバモイル) -N- (4-フルオロフェニル) アミノ} エチル基、2- [N-ベンジル-N- (N-ブチルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- {N- (N-ブチルカルバモイル) -N- (4-フルオロフェニルメチル) アミノ} エチル基、2- {N- (N-ブチルカルバモイル) -N- [2- (4-フルオロフェニル) エチル] アミノ} エチル基、2- [N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) -N-メチルアミノ] エチル基、2- [N-ブチル-N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-イソブチル-N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-シクロペンチル-N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-シクロヘキシルメチル-N- (N-イ



ソプロピルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) -N-フェニルアミノ] エチル基、2- {N- (4-フルオロフェニル) -N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) アミノ} エチル基、2- [N-ベンジル-N- (N-イソプロピルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- (N-イソブチルオキシカルボニル-N-メチルアミノ) エチル基、2- (N-ブチル-N-イソブチルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチル-N-イソブチルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチル-N-イソブチルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロヘキシルメチル-N-イソブチルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチルオキシカルボニル-N-フェニルアミノ) エチル基、2- [N- (4-フルオロフェニル) -N-イソブチルオキシカルボニルアミノ] エチル基、2- (N-ベンジル-N-イソブチルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- [N- (N-シクロペンチルカルバモイル) -N-メチルアミノ] エチル基、2- [N-ブチル-N- (N-シクロペンチルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-シクロペンチルカルバモイル) -N-イソブチルアミノ] エチル基、2- [N-シクロペンチル-N- (N-シクロペンチルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-シクロヘキシルメチル-N- (N-シクロペンチルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-シクロペンチルカルバモイル) -N-フェニルアミノ] エチル基、2- [N-ベンジル-N- (N-シクロペンチルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) -N-メチルアミノ] エチル基、2- [N-ブチル-N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) -N-イソブチルアミノ] エチル基、2- [N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) -N-シクロペンチルアミノ] エチル基、2- [N-シクロヘキシルメチル-N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) -N-フェニルアミノ] エチル基、2- [N-ベンジル-N- (N-シクロヘキシルチオカルバモイル) アミノ] エチル基、2- (N-メチル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-ブチル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-イソブチル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロペンチル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-シクロヘキシルメチル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-フェニル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- (N-ベンジル-N-フェニルオキシカルボニルアミノ) エチル基、2- [N-メチル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-ブチル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-イソブチル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-シクロペンチル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-シクロヘキシルメチル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基、2- [N-フェニル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基、又は2- [N-ベンジル-N- (N-フェニルカルバモイル) アミノ] エチル基などが挙げられる。

#### 【0250】

前記一般式 (I) における  $R_s$  が  $-N(R_y)(R_z)$  を表すとき、 $R_z$  は  $R_x$  と同義であるか、あるいは  $-A^5-Re$  基を表すものと定義される。 $-A^5-Re$  については前述のものと同義である。

#### 【0251】

$R_z$  の特に好ましい例としては、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-

フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フ

エニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、(モルホリノー4-イル)カルボニル基などが挙げられる。

#### 【0252】

R<sub>y</sub>は水素原子、炭素数1~8個のアルキル基、又は-A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub>基を表すか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数3~7の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成しているものを表す。炭素数1~8個のアルキル基は、直鎖状若しくは分岐状の飽和アルキル基又は直鎖状若しくは分岐状の部分的に不飽和結合を含むアルキル基、あるいは炭素数3~7の環状アルキル基を含んでもよいアルキル基を表す。例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、2-メチルブチル基、2,2-ジメチルプロピル基、ヘキシル基、4-メチルペンチル基、2,3-ジメチルブチル基、2-エチルブチル基、ヘプチル基、オクチル基、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロプロピルメチル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基、2-メチルシクロペンチル基、3-メチルシクロペンチル基、3,4-ジメチルシクロペンチル基、4-メチルシクロヘキシル基、4,4-ジメチルシクロヘキシル基、4-エチルシクロヘキシル基、4-メチルシクロヘキシルメチル基等が挙げられる。-A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub>は前述のものと同義である。

R<sub>y</sub>の特に好ましい例としては、水素原子、メチル基、エチル基、イソブチル基などが挙げられる。

#### 【0253】

またR<sub>y</sub>はR<sub>z</sub>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに原子数3~7の飽和又は不飽和の含窒素環状置換基を形成しているものを表すが、これらの具体例としては、1-ピロリジノ基、1-ピペラジノ基、4-モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、ピラゾール-1-イル基などの窒素原子を含む環状置換基が挙げられ、これらはいずれも好ましい例である。

#### 【0254】

前記一般式(I)におけるARは、部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環(ar)の残基として定義される。またARは1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい。複素環(ar)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれる同一若しくは異なる環構成ヘテロ原子を1~4個含む環を意味する。

#### 【0255】

「縮合二環式の炭素環あるいは複素環」とは原子数8~11個の部分不飽和又は完全不飽和である環を意味する。好ましくは窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個含む5員環の複素環同士が融合した8個の原子からなる部分不飽和又は完全不飽和である環、窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個を含む5員環の複素環と6員環の炭素環又は窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択されたヘテロ原子を1又は2個含む6員環複素環とが融合した9個の原子からなる部分不飽和又は完全不飽和である環、あるいは6員環の炭素環又は窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個を含む6員環複素環と6員環の炭素環又は窒素、酸素、及びイオウ原子からなる群から選択された環構成ヘテロ原子を1又は2個を含む6員環複素環とが融合した10

個の原子からなる部分不飽和又は完全不飽和である置換基が例として挙げられる。ARを構成する環のうちでヘテロ原子を含まない炭素環の場合、ナフタレン環は特に好ましい例である。またARを構成する環のうちで環構成ヘテロ原子を含む複素環(ar)のうち、環構成ヘテロ原子の数は1~2個の場合が好ましい例である。

#### 【0256】

一般式(I)におけるARにおいて、ARを構成する好適な環の具体的な例としては、ナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ[d]イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ[c]イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ[1,2-a]ピリジン、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン、イソキノリン、ジヒドロ-2H-イソキノリン、シンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン、ベンゾ[1,2,5]チアジアゾール、1H-ベンゾトリアゾール、1,3-ジヒドロピロロ[2,3-b]ピリジン、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール、フタラジン、[1,8]ナフタリジン、[1,5]ナフタリジン、1H-ピロロ[3,2-c]ピリジン、1H-ピロロ[2,3-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[4,3-b]ピリジン、1H-ピラゾロ[4,3-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[3,4-c]ピリジン、1H-ピラゾロ[3,4-b]ピリジン、[1,2,4]トリアゾロ[4,3-a]ピリジン、チエノ[3,2-c]ピリジン、チエノ[3,2-b]ピリジン、1H-チエノ[3,2-c]ピラゾール、ベンゾ[d]イソオキサゾール、ベンゾ[c]イソオキサゾール、インドリジン、1,3-ジヒドロインドール、1H-ピラゾロ[3,4-d]チアゾール、2H-イソインドール、[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリミジン、1H-ピラゾロ[3,4-b]ピラジン、1H-イミダゾ[4,5-b]ピラジン、7H-プリン、4H-クロメンなどが挙げられる。これらのうちナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ[d]イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ[c]イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ[1,2-a]ピリジン、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン、イソキノリン及びジヒドロ-2H-イソキノリンは特に好ましい一群であり、またシンノリン、キナゾリン、キノキサリン、1H-ベンゾイミダゾール、ベンゾオキサゾール、1H-ピロロ[3,2-b]ピリジン、ベンゾ[1,2,5]チアジアゾール、1H-ベンゾトリアゾール、1,3-ジヒドロピロロ[2,3-b]ピリジン、1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール及びジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾールも特に好ましい一群である。さらにナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、キノリン、1H-インダゾール及びイソキノリンは非常に好ましい例である。

#### 【0257】

ARは、AR上の任意の炭素原子と前記一般式(I)中の芳香環(E)上のC<sup>2</sup>、C<sup>3</sup>、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、又はC<sup>6</sup>のうち何れかの環構成炭素原子とで結合している。ARを構成する環のうち、芳香環(E)と置換位置を特定した好適な例としては、ナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[

d) イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、4

H-クロメン-5-イル基などが挙げられる。これらのうちナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基及びベンゾオキサゾール-5-イル基などは特に好ましい一群であり、ナフタレン-2-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基などは非常に好ましい例である。

またARは1個又は同一若しくは異なる2以上のXaで置換されていてもよい。Xaの置換位置としては芳香環(E)と結合していないAR上の炭素原子、及び/又は窒素原子が存在する場合はその窒素原子上が挙げられる。

#### 【0258】

置換基Xaは炭素数1~4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、炭素数3~7個の環状飽和アルキル基、オキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、 $-(CH_2)_iR^{14}$ 、 $-OR^{10}$ 、 $-N(R^{11})(R^{12})$ 、 $-SO_2R^{13}$ 、又は $-COR^2$ を表す。但しAR中に窒素原子が存在する場合、その窒素原子に置換してもよいXaは炭素数1~4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、炭素数3~7個の環状飽和アルキル基、又は $-(CH_2)_iR^{14}$ の何れかを表す。

置換基Xaのうちオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、又はトリフルオロメチル基は好ましい例である。

置換基Xaのうち炭素数1~4個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基とは、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt-ブチル基などが挙げられ、これらのうちメチル基、エチル基、又はプロピル基は特に好ましい例である。

#### 【0259】

また炭素数3~7個の環状飽和アルキル基としてはシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、又はシクロヘプチル基などが挙げられる。

$-(CH_2)_iR^{14}$ は、前述のものと同義であるが、これらうち2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基は好ましい例であり、2-ヒドロキシエチル基は特に好ましい例である。

#### 【0260】

$-OR^{10}$ の $R^{10}$ は水素原子、炭素数1~4個の低級アルキル基、又は $-(CH_2)_iR^{14}$ 基を表し、これらのうち水素原子は特に好ましい例である。炭素数1~4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基等が挙げられる。このうちメチル基は特に好ましい例である。 $-(CH_2)_iR^{14}$ は前述のものと同義である。従って、 $-OR^{10}$ のうち水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基などは好ましい例であり水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基は特に好ましい例である。

#### 【0261】

$-N(R^{11})(R^{12})$ の $R^{11}$ は水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基を表し、 $R^{12}$ は水素原子、炭素数1~4個の低級アルキル基、炭素数2~4個のヒドロキシアリル基

、 $-\text{COR}^{15}$ 、又は $-\text{SO}_2\text{R}^{16}$ を示すか、あるいは $\text{R}^{11}$ と繋がってそれらが結合する窒素原子とともに3～6員環を形成して飽和の含窒素シクロアルキル基又はモルホリノ基を形成する。 $-\text{COR}^{15}$ 中の $\text{R}^{15}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、炭素数2～4個のヒドロキシアルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基、又は $-\text{A}^6-\text{Qa}$ を表す。また $-\text{SO}_2\text{R}^{16}$ 中の $\text{R}^{16}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。 $-\text{N}(\text{R}^{11})(\text{R}^{12})$ の具体的な例としてはアミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ピペリジノ基、ピロリジノ基、モルホリノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンゾイル基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、N-メチルカルバモイルアミノ基、N, N-ジメチルカルバモイルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、スルファモイルアミノ基、N-メチルスルファモイルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基などが挙げられ、このうち好ましい例としてはアミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、又は(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基などが挙げられ、アミノ基、N-メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、又は2-ヒドロキシエチルアミノ基は特に好ましい例として挙げられる。

#### 【0262】

$-\text{SO}_2\text{R}^{13}$ の $\text{R}^{13}$ は炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。 $-\text{SO}_2\text{R}^{13}$ の好適な例としてはメタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、又はN, N-ジメチルスルファモイル基などが挙げられる。

$-\text{COR}^{27}$ の $\text{R}^{27}$ は水素原子、水酸基又は炭素数1～4個のアルコキシ基、炭素数1～4個の低級アルキル基、アミノ基、又は炭素数1～4個のモノ若しくはジアルキルアミノ基を表す。 $-\text{COR}^{27}$ の具体的な例としてはホルミル基、カルボキシル基、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、アセチル基、プロピオニル基、カルバモイル基、N-メチルカルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基などが挙げられ、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基などは好ましい例であり、カルボキシル基は特に好ましい例である。

#### 【0263】

基Xaのうち好ましい例としてはオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基などが挙げられる。また基Xaのうち特に好ましい例としては、オキソ基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、又はカルボキシル基などが挙げられる。窒素原子上に置換してもよい基Xaのうち好ましい例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、又はN, N-ジメチルカルバモイルメチル基が挙げ

られ、このうち特に好ましい例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、又は2-ヒドロキシエチル基が挙げられる。

# 【0264】

基Xaで置換されているか又は無置換のARのうち、好ましい例としては、ナフタレン-1-イル基、ナフタレン-2-イル基、6-フルオロナフタレン-2-イル基、6-クロロナフタレン-2-イル基、6-(トリフルオロメチル)ナフタレン-2-イル基、5-ヒドロキシナフタレン-1-イル基、5-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-1-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、7-ヒドロキシナフタレン-1-イル基、7-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、5-メトキシナフタレン-1-イル基、5-メトキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-1-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、7-メトキシナフタレン-1-イル基、7-メトキシナフタレン-2-イル基、5-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、7-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、5-(カルボキシメチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-(カルボキシメチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、7-(カルボキシメチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、5-(N,N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、7-(N,N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、5-アミノナフタレン-1-イル基、5-アミノナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-1-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、7-アミノナフタレン-1-イル基、7-アミノナフタレン-2-イル基、5-(N-メチルアミノ)ナフタレン-1-イル基、5-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-1-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、7-(N-メチルアミノ)ナフタレン-1-イル基、7-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、5-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-1-イル基、5-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-1-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、7-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-1-イル基、7-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、5-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、7-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、5-アセチルアミノナフタレン-2-イル基、6-アセチルアミノナフタレン-2-イル基、6-(2-アミノアセチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシアセチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、7-(2-ヒドロキシアセチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-[ (フラン-2-カルボニル) アミノ] ナフタレン-2-イル基、7-[ (フラン-2-カルボニル) アミノ] ナフタレン-2-イル基、6-[ (ベンゼン-2-カルボニル) アミノ] ナフタレン-2-イル基、7-[ (ベンゼン-2-カルボニル) アミノ] ナフタレン-2-イル基、6-カルバモイルアミノナフタレン-2-イル基、6-メチルスルホニルアミノナフタレン-2-イル基、6-スルファモイルアミノナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルスルファモイルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-メタンスルホニルナフタレン-2-イル基、6-スルファモイルナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルスルファモイル)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルスルファモイル)ナフタレン-2-イル基、6-カルボキシナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-4-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-4-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-4-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-4-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-カルボキシベンゾ[b]フラン-4-イル基、2-カルボキシベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-カルボキシ-3-メチルベンゾ[b]フラン-4-イル基、2-カルボキシ-3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-アセチルベンゾ[b]フ



ラン-4-イル基、3-アセチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、3-アセチル-2-メチルベンゾ [b] フラン-4-イル基、3-アセチル-2-メチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、3-ヒドロキシメチルベンゾ [b] フラン-4-イル基、3-ヒドロキシメチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチルベンゾ [b] フラン-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、ベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、ベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、2-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、3-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、2-カルボキシベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、2-カルボキシベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、2-カルボキシ-3-メチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、2-カルボキシ-3-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、3-アセチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、3-アセチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、3-アセチル-2-メチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、3-アセチル-2-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、3-ヒドロキシメチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、3-ヒドロキシメチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチルベンゾ [b] チオフェン-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、1H-インドール-4-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-4-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-3-メチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-4-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-メチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-メチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1, 3-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1, 2-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-1-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-1-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-1, 2-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-4-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-エチル-1

H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-エチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-エチル-3-メチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-エチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-エチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-エチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-4-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-4-イル基、3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-4-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-4-イル基

、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-4-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-カルボキシメチル-1H-インドール-4-イル基、1-カルボキシメチル-1H-インドール-5-イル基、1-カルボキシメチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-カルボキシメチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-カルボキシメチル-3-メチル-1H-インドール

ル-4-イル基、1-カルボキシメチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-カルボキシメチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-4-イル基、1-カルボキシメチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-カルボキシメチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-カルボキシメチル-1H-インドール-5-イル基、2-カルボキシ-1-カルボキシメチル-3-メチル-1H-インドール-4-イル基、2-カルボキシ-1-カルボキシメチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-カルボキシメチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-カルボキシメチル-1H-インドール-5-イル基、3-アセチル-1-カルボキシメチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、3-アセチル-1-カルボキシメチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-カルボキシメチル-3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-4-イル基、1-カルボキシメチル-3-ヒドロキシメチル-1H-インドール-5-イル基、1-カルボキシメチル-3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-4-イル基、1-カルボキシメチル-3-ヒドロキシメチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-(N-メチルアミノ)ベンゾチアゾール-6-イル基、2-(N, N-ジメチルアミノ)ベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、2-メチルキノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-メチルキノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、3-メチルベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、3-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(カルボキシメチル)-1H-インダゾール-5-イル基、1-(カルボキシメチル)-3-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、3-メチルベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、2-メチル-2H-インダゾール-5-イル基、2, 3-ジメチル-2H-インダゾール-5-イル基、2-エチル-2H-インダゾール-5-イル基、2-エチル-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル基、2-プロピル-2H-インダゾール-5-イル基、3-メチル-2-プロピル-2H-インダゾール-5-イル基、2-(2-ヒドロキシエチル)-2H-インダゾール-5-イル基、2-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル基、2-(カルボキシメチル)-2H-インダゾール-5-イル基、2-(カルボキシメチル)-3-メチル-2H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、2-メチル-イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、2, 3-ジメチル-イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、2-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、3-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、

1, 2, 3-トリメチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(カルボキシメチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(カルボキシメチル)-2-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(カルボキシメチル)-3-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(カルボキシメチル)-2, 3-ジメチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-メチルイソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、2-メチルキナゾリン-6-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、2-メチルキノキサリン-6-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、1-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、2-メチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、2-メチルベンゾオキサゾール-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、2-メチル-1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、3-メチル-1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1-メチル-1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1-エチル-1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-2-オン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-2-オン-4-イル基、1-メチル-1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-2-オン-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン-4-イル基、1-メチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-チオン-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-チオン-4-イル基、1-メチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-チオン-5-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-オン-6-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-オン-7-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-オン-5-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-オン-4-イル基、3-メチル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン-6-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-チオン-6-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-チオン-7-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-チオン-5-イル基、3H-ベンゾオキサゾール-2-チオン-4-イル基、3-メチル-3H-ベンゾオキサゾール-2-チオン-6-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1

, 5] オフタリジン-3-イル基、[1, 5] ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ  
[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-4-イル  
基、1-メチル-1H-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、1-エチル-1H  
-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、2-メチル-1H-ピロロ[3, 2-c  
] ピリジン-6-イル基、3-メチル-1H-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-6-イル  
基、1, 3-ジメチル-1H-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、1H-ピロ  
ロ[2, 3-c] ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-4-イ  
ル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-5-イル基、1-エチル-1  
H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-5-イル基、2-メチル-1H-ピロロ[2, 3-  
c] ピリジン-5-イル基、3-メチル-1H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-5-イ  
ル基、1, 3-ジメチル-1H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-5-イル基、1H-ピ  
ラ

ゾロ[4, 3-b] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b] ピリジン-6  
-イル基、1-メチル-1H-ピラゾロ[4, 3-b] ピリジン-5-イル基、1-エチ  
ル-1H-ピラゾロ[4, 3-b] ピリジン-5-イル基、3-メチル-1H-ピラゾロ  
[4, 3-b] ピリジン-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-ピラゾロ[4, 3-b  
] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-6-イル基、1H-  
ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-4-イル基、1-メチル-1H-ピラゾロ[4, 3-  
c] ピリジン-6-イル基、1-エチル-1H-ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-6-  
イル基、3-メチル-1H-ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-6-イル基、1, 3-ジ  
メチル-1H-ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4  
-c] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c] ピリジン-4-イル基、1  
-メチル-1H-ピラゾロ[3, 4-c] ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピ  
ラゾロ[3, 4-c] ピリジン-5-イル基、3-メチル-1H-ピラゾロ[3, 4-c  
] ピリジン-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-ピラゾロ[3, 4-c] ピリジン-  
5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3  
, 4-b] ピリジン-4-イル基、1-メチル-1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン  
-5-イル基、1-エチル-1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン-5-イル基、3-  
メチル-1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H  
-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン-5-イル基、[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-  
a] ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-7-イ  
ル基、3-メチル[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-6-イル基、チエ  
ノ[3, 2-c] ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c] ピリジン-3-イル基、  
チエノ[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、2-メチルチエノ[3, 2-c] ピリジン  
-2-イル基、3-メチルチエノ[3, 2-c] ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2  
-b] ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b] ピリジン-3-イル基、チエノ[3  
, 2-b] ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b] ピリジン-6-イル基、2-メ  
チルチエノ[3, 2-b] ピリジン-2-イル基、3-メチルチエノ[3, 2-b] ピリ  
ジン-2-イル基、1H-チエノ[3, 2-c] ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ  
[3, 2-c] ピラゾール-4-イル基、1-メチル-1H-チエノ[3, 2-c] ピラ  
ゾール-5-イル基、1-エチル-1H-チエノ[3, 2-c] ピラゾール-5-イル基  
、3-メチル-1H-チエノ[3, 2-c] ピラゾール-5-イル基、1, 3-ジメチル  
-1H-チエノ[3, 2-c] ピラゾール-5-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール  
-5-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾ  
ール-6-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-7-イル基、3-メチルベンゾ[d  
] イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ  
[c] イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-6-イル基、ベ  
ンゾ[c] イソオキサゾール-7-イル基、3-メチルベンゾ[c] イソオキサゾール-  
5-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8

－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－2－オン－5－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－2－オン－4－イル基、1, 3－ジヒドロインドール－2－オン－6－イル基、1－メチル－1, 3－ジヒドロインドール－2－オン－5－イル基、1H－ピラゾロ〔3, 4－d〕チアゾール－5－イル基、2H－イソインドール－5－イル基、2H－イソインドール－4－イル基、2－メチル－2H－イソインドール－5－イル基、4H－クロメン－6－イル基、4H－クロメン－5－イル基、クロメン－4－オン－7－イル基、クロメン－4－オン－6－イル基などが挙げられる。

#### 【0265】

また、特に好ましい例としては、ナフタレン－2－イル基、6－ヒドロキシナフタレン－2－イル基、6－メトキシナフタレン－2－イル基、6－（2－ヒドロキシエチルオキシ）ナフタレン－2－イル基、6－アミノナフタレン－2－イル基、6－（N－メチルアミノ）ナフタレン－2－イル基、6－（N, N－ジメチルアミノ）ナフタレン－2－イル基、6－（2－ヒドロキシエチルアミノ）ナフタレン－2－イル基、ベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕フラン－5－イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、3－メチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、2, 3－ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン－5－イル基、1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－メチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1, 2, 3－トリメチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－エチル－2, 3－ジメチル－1H－インドール－5－イル基、1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、3－メチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－プロピル－1H－インドール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－2－メチル－1H－インドール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－3－メチル－1H－インドール－5－イル基、2, 3－ジメチル－1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インドール－5－イル基、ベンゾチアゾール－6－イル基、2－メチルベンゾチアゾール－6－イル基、2－メトキシベンゾチアゾール－6－イル基、2－アミノベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－オキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、2－チオキソ－3－メチル－2, 3－ジヒドロベンゾチアゾール－6－イル基、キノリン－3－イル基、キノリン－6－イル基、2－オキソ－1, 2－ジヒドロキノリン－6－イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール－5－イル基、1H－インダゾール－5－イル基、1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－プロピル－1H－インダゾール－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、3－ヒドロキシ－1－メチル－1H－インダゾール－5－イル基、1－エチル－3－ヒドロキシ－1H－インダゾール－5－イル基、イミダゾ〔1, 2－a〕ピリジン－6－イル基、1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－メチル－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－エチル－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－プロピル－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、1－（2－ヒドロキシエチル）－1H－ピロロ〔2, 3－b〕ピリジン－5－イル基、イソキノリン－6－イル基、1－オキソ－1, 2－ジヒドロイソキノリン－6－イル基、シンノリン－6－イル基、又はベンゾオキサゾール－5－イル基などが挙げられる。

#### 【0266】

さらに、非常に好ましい例としては、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基などが挙げられる。

#### 【0267】

前記一般式(I)における基Yは水素原子、炭素数1~4個の低級アルキル基、 $-(CH_2)_mN(R^{18})(R^{19})$ 、又は $-C(R^{20})_2OC(O)A^3R^{21}$ として定義され、このうち水素原子は特に好ましい例である。

炭素数1~4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基などが挙げられる。このうちメチル基、エチル基は特に好ましい例である。

#### 【0268】

$-(CH_2)_mN(R^{18})(R^{19})$ のうちmは整数2又は3と定義される。R<sup>18</sup>はR<sup>19</sup>と同じであるか、R<sup>19</sup>と繋がって窒素原子とともに3~6員環を形成している飽和の含窒素シクロアルキル基を示すか又は窒素原子とともにモルホリノ基を形成しているものであり、R<sup>19</sup>はメチル基、エチル基又はプロピル基として定義される。 $-(CH_2)_mN(R^{18})(R^{19})$ の例としては2-(N, N-ジメチルアミノ)エチル基、2-(N, N-ジエチルアミノ)エチル基、2-(N, N-ジプロピルアミノ)エチル基、3-(N, N-ジメチルアミノ)プロピル基、3-(N, N-ジエチルアミノ)プロピル基、2-(N, N-ジプロピルアミノ)プロピル基、2-ピロリジン-1-イルエチル基、2-ピペリジン-1-イルエチル基、2-モルホリン-4-イルエチル基、3-ピロリジン-1-イルプロピル基、3-ピペリジン-1-イルプロピル基、3-モルホリン-4-イルプロピル基などが挙げられる。

#### 【0269】

$-C(R^{20})_2OC(O)A^3R^{21}$ のうちR<sup>20</sup>は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基と定義される。R<sup>21</sup>は炭素数1~4個の低級アルキル基、炭素数3~6個の環状飽和アルキル基又はフェニル基と定義される。炭素数1~4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基等が挙げられ、炭素数3~6個の環状飽和アルキル基はシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。A<sup>3</sup>は単結合又は酸素原子と定義される。 $-C(R^{20})_2OC(O)A^3R^{21}$ の例としてはアセトキシメチル基、プロピオニルオキシメチル基、ブチリルオキシメチル基、(2-メチルプロピオニル)オキシメチル基、(2, 2-ジメチルプロピオニル)オキシメチル基、シクロプロピオニルオキシメチル基、シクロペンタノイルオキシメチル基、シクロヘキサノイルオキシメチル基、フェニルカルボキシメチル基、1-アセトキシ-1-メチルエチル基、1-メチル-1-(2-メチルプロピオニルオキシ)エチル基、1-シクロペンタノイルオキシ-1-メチルエチル基、1-シクロヘキサノイルオキシ-1-メチルエチル基、メトキシカルボニルオキ

シメチル基、エトキシカルボニルオキシシメチル基、イソプロピルオキシカルボニルオキシシメチル基、*t*-ブチルオキシカルボニルオキシシメチル基、シクロプロピルオキシカルボニルオキシシメチル基、シクロペンチルオキシカルボニルオキシシメチル基、シクロヘキシルオキシカルボニルオキシシメチル基、フェニルオキシカルボニルオキシシメチル基、1-メトキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-エトキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-イソプロピルオキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-*t*-ブチルオキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-シクロプロピルオキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-シクロペンチルオキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ-1-メチルエチル基、1-メチル-1-フェニルオキシカルボニルオキシエチル基などが挙げられる。

# 【0270】

本発明の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又はその塩において、以下の条件を全て満足する。

$n$ は1~3の何れかの整数を示す。

$AR$ は $C^2$ に結合しており、 $Rs$ は $C^3$ 、 $C^4$ あるいは $C^5$ の何れかの原子に結合しており、 $C^3$ 、 $C^4$ 、又は $C^5$ のうち $Rs$ が結合していない環構成炭素原子は $V$ で置き換えられていてもよい。

$V$ は窒素原子を示すか、あるいは $Zx$ で置換された炭素原子を示し、 $Zx$ は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、*N*-メチルアミノ基、*N*-エチルアミノ基、*N*-プロピルアミノ基、*N*-イソプロピルアミノ基、*N*、*N*-ジメチルアミノ基、*N*、*N*-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は $N$ 、*N*-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

$Rs$ は $-D-Rx$ 又は $-N(Ry)(Rz)$ を示す。 $D$ は酸素原子又はイオウ原子を示す。 $Rx$ はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基を示すか、あるいは $Rb$ 又は $Rc$ を示す。 $Rb$ 中の $Q$ はフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。 $A^2$ は単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、又は $-N$ (エチル)-を示す(但し $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$ (メチル)-、 $-N$ (エチル)-を示すとき $A^1$ はエチレンを示す)。 $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す(但し $Q$ がフェニル基を示し、 $A^1$ が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつ $A^2$ が単結合を示すときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。 $Rc$ 中の $p$ は整数2又は3を示し、 $A^4$ は単結合又はメチレンを示す。 $A^5$ は $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 又は $-S(O)_2-$ を示す。 $Rd$ は水素原子を示すか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。 $Re$ はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*t*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、



イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、*N*-メチルアミノ基、*N*, *N*-ジメチルアミノ基、*N*-エチルアミノ基、*N*, *N*-ジエチルアミノ基、*N*-プロピルアミノ基、*N*-イソプロピルアミノ基、*N*-ブチルアミノ基、*N*-イソブチルアミノ基、*N*-*t*-ブチルアミノ基、*N*-シクロプロピルアミノ基、*N*-シクロペンチルアミノ基、*N*-シクロヘキシルアミノ基、*N*-フェニルアミノ基、*N*-(4-メチルフェニル)アミノ基、*N*-(4-クロロフェニル)アミノ基、*N*-(4-フルオロフェニル)アミノ基、*N*-(ピリジン-2-イル)アミノ基、*N*-(ピリジン-3-イル)アミノ基、*N*-(ピリジン-4-イル)アミノ基、*N*-(フラン-2-イル)アミノ基、*N*-(フラン-3-イル)アミノ基、*N*-(チオフェン-2-イル)アミノ基、*N*-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。

*R*<sub>2</sub>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(*N*, *N*-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロ

フェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基又はピラゾール-1-イル基を形成しているものを示す。

A Rはナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピ

リジン-7-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（これらの基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示す。置換基Xaはオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチル

カルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基又はエチル基を示す。

【0271】

また本発明の別の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

nは1~3の何れかの整数を示す。

ARはC<sup>3</sup>に結合しており、RsはC<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、又はC<sup>6</sup>の何れかの原子に結合しており、C<sup>4</sup>、C<sup>5</sup>、又はC<sup>6</sup>のうちRsが結合していない環構成炭素原子はVで置き換えられていてもよい。

Vは窒素原子を示すか、あるいはZxで置換された炭素原子を示し、Zxは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

Rsは-D-Rx又は-N(Ry)(Rz)を示す。Dは酸素原子又はイオウ原子を示す。Rxはブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基あるいはRb又はRcを示す。Rb中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。A<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-又は-N(エチル)-を示す(但しA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-を示すときA<sup>1</sup>はエチレンを示す)。R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す(但しQがフェニル基を示し、A<sup>1</sup>が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつA<sup>2</sup>が単結合を示すときには、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。Rc中のpは整数2又は3を示し、A<sup>4</sup>は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup>は-C(O)-、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-を示す。Rdは水素原子を示すか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。Reはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチ

ルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。R<sub>2</sub>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニ

ル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、*N*-イソプロピルカルバモイル基、*N*-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、*N*-ブチルカルバモイル基、*N*-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、*N*-イソブチルカルバモイル基、*N*-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、*N*-*t*-ブチルカルバモイル基、*N*-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、*N*-シクロプロピルカルバモイル基、*N*-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、*N*-シクロペンチルカルバモイル基、*N*-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、*N*-シクロヘキシルカルバモイル基、*N*-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、*N*-フェニルカルバモイル基、*N*-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、*N*-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、*N*-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基又はピラゾール-1-イル基を形成する。

ARはナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソ

キノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示す。置換基Xaはオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルス

ルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル) アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

#### 【0272】

また本発明の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足するものを除く。

nは1~3の何れかの整数を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はR<sup>s</sup>が結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>はZ<sup>x</sup>で置換されていてもよい環構成炭素原子を示し、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Z<sup>x</sup>は、フッ素原子、塩素原子、ニトロ基、アミノ基、メチル基、又はOR<sup>9</sup>基を示し、

R<sup>9</sup>は水素原子又は炭素数1~4個の低級アルキル基を示す。

R<sup>s</sup>は-O-R<sup>x</sup>を示す。R<sup>x</sup>は、炭素数3~8個の直鎖状又は分枝状飽和アルキル基を示すか、あるいはR<sup>a</sup>又はR<sup>b</sup>を示し、R<sup>b</sup>中のQは部分不飽和又は完全不飽和である単環又は縮合二環式の炭素環あるいは複素環(q)の残基を示し、環上の任意の位置でA<sup>2</sup>と結合する。複素環(q)は窒素原子、酸素原子、及び硫黄原子からなる群から選ばれた同一若しくは異なる環構成ヘテロ原子を1~2個含む。

ARはナフタレン、ベンゾフラン、ベンゾ[b]チオフェン、インドール、ベンゾチアゾール、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール、キノリン、ジヒドロ-1H-キノリン、ベンゾ[d]イソチアゾール、1H-インダゾール、ベンゾ[c]イソチアゾール、2H-インダゾール、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン、イソキノリン、又はジヒドロ-2H-イソキノリンの残基(上記の残基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよい)の何れかを示す。

#### 【0273】

さらに本発明の別の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

nは1~3の何れかの整数を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はR<sup>s</sup>が結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>はVで置き換えられていてもよく、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Vは窒素原子を示すか、あるいはZ<sup>x</sup>で置換された炭素原子を示し、Z<sup>x</sup>は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

R<sup>s</sup>は-O-R<sup>x</sup>を示す。R<sup>x</sup>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基あるいはR<sup>b</sup>又はR<sup>c</sup>を示す。R<sup>b</sup>中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシ基の何れかの基を示す。A<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-を示す(但しA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-を示すときA<sup>1</sup>はエチレンを示す)。R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す(但しQがフェニル基を示し、A<sup>1</sup>が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつA<sup>2</sup>が単結合を示すときには、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。R<sup>c</sup>中のpは整数2又は3を示し、A<sup>4</sup>は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup>は-C(



O) -、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-を示す。R<sub>d</sub>は水素原子を示すか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。R<sub>e</sub>はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、*t*-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-*t*-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。

A<sub>R</sub>はシンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル

基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX aで置換されていてもよい）の何れかを示す。置換基X aはオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、（N, N-ジメチルスルファモイル）アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基又はエチル基を示す。

#### 【0274】

またさらに本発明の別の好ましい態様では、一般式（I）で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

nは1～3の何れかの整数を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>はVで置き換えられていてもよく、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Vは窒素原子を示すか、あるいはZxで置換された炭素原子を示し、Zxは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

Rsは-S-Rxを示す。Rxはブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基あるいはRb又はRcを示す。Rb中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。A<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、イオウ原子

、 $-N$  (メチル)、 $-$ 又は $-N$  (エチル)  $-$ を示す (但し $A^2$ が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は $-N$  (エチル)  $-$ を示すとき $A^1$ はエチレンを示す)。  $R^2$ 及び $R^3$ はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基又、はメチルスルホニルアミノ基を示す (但し $Q$ がフェニル基を示し、 $A^1$ が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつ $A^2$ が単結合を示すときには、 $R^2$ 又は $R^3$ のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。  $R^c$ 中の $p$ は整数2又は3を示し、 $A^4$ は単結合又はメチレンを示す。 $A^5$ は $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 又は $-S(O)_2-$ を示す。 $R^d$ は水素原子若しくはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。 $R^e$ はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-フルオロフェニル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-3-イル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-4-イル)アミノ基、 $N$ -(フラン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(フラン-3-イル)アミノ基、 $N$ -(チオフェン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。

$AR$ はナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-

6-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示す。置換基Xaはオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N、N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキ

シ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

# 【0275】

また本発明の別の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

nは1~3の何れかの整数を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>2</sup>、C<sup>5</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Rsは-N(Ry)(Rz)を示す。Rzはブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニル

オキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基、イソブチル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノ-1-イル)カルボニル基、(ピペリジノ-1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノ-4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基又はピラゾール-1-イル基を形成する。

A Rはナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピ

リジン-7-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-d〕チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔1, 5-a〕ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ〔4, 5-b〕ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX aで置換されていてもよい）を示す。置換基X aはオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカ

ルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシル基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

# 【0276】

また本発明の別の好ましい態様では、一般式(I)で表される化合物又は塩において以下の条件を全て満足する。

nは1~3の何れかの整数を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>はVで置き換えられていてもよく、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Vは窒素原子を示すか、あるいはZxで置換された炭素原子を示し、Zxは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

Rsは-D-Rcを示し、Dは酸素原子又はイオウ原子を示す。Rc中のpは整数2又は3を示し、A<sup>4</sup>は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup>は-C(O)-、-C(S)-又は-S(O)<sub>2</sub>-を示す。Rdは水素原子若しくはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。Reはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。



ARはナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-4-イル基、ベンゾ〔b〕チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ〔c〕イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ〔1, 2, 5〕チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 8〕ナフタリジン-4-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-3-イル基、〔1, 5〕ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔3, 2-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-b〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ〔4, 3-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-c〕ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ〔3, 4-b〕ピリジン-4-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-6-イル基、〔1, 2, 4〕トリアゾロ〔4, 3-a〕ピリジン-7-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-c〕ピリジン-6-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-2-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-3-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-5-イル基、チエノ〔3, 2-b〕ピリジン-6-イル基、1H-チエノ〔3, 2-c〕ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ〔

3, 2-c] ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d] チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5-a] ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b] ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のXaで置換されていてもよい）を示す。置換基Xaはオキソ基、チオキソ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル) アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

#### 【0277】

本発明の特に好ましい態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>2</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>3</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はVで置き換えられていてもよく、C<sup>5</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Vは、窒素原子を示すか、あるいはZxで置換された炭素原子を示し、Zxはフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。

Rsは-O-Rxを示す。Rxは、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチ

ル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

ARはナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-

ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

# 【0278】

また本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>2</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>はVで置き換えられていてもよくC<sup>3</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Vは窒素原子を示すか、あるいはZxで置換された炭素原子を示し、Zxはフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN,N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。

Rsは-O-Rxを示す。Rxはブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5,7-ジフルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2,3-ジメチルフェニルメチル基、3,5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2,3-ジフルオロフェニルメチル基、2,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,5-ジフルオロフェニルメチル基、3,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,3-ジクロロフェニルメチル基、2,4-ジクロロフェニルメチル基、2,5-ジクロロフェニルメチル基、2,6-ジクロロフェニルメチル基、3,4-ジクロロフェニルメチル基、3,5-ジクロロフェニルメチル基、3,6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メ

トキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基の何れかの基を示す。

ARはナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノ

リン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基 Y は水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

【0279】

さらに本発明の特に好ましい別の態様は、一般式 (I) で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

n は整数 2 を示す。

C<sup>3</sup> は A R が結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup> は R s が結合した炭素原子を示し、C<sup>2</sup>、C<sup>4</sup> 及び C<sup>6</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

R s は -O-R x を示す。R x はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は 2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

A R はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル

基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

#### 【0280】

また本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>は窒素原子を示し、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Rsは-O-Rxを示す。Rxはブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-

2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

ARはナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシアチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシアチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル



基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基又はエチル基を示す。

#### 【0281】

さらに本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>6</sup>はZxで置換された炭素原子を示し、C<sup>2</sup>及びC<sup>5</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Zxはフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN,N-ジメチルアミノ基を示す。

Rsは-O-Rxを示す。Rxは、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2,3-ジメチルフェニルメチル基、3,5-ジメチルフェニルメチル基、2-フ

ルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

ARは、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-イ

基 Y は水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

また本発明の特に好ましい別の態様は、一般式（I）で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

C<sup>3</sup>はA Rが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はR sが結合した炭素原子を示し、C<sup>2</sup>、C<sup>5</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

R s は -N(R y)(R z) を示す。R z は プチル基、イソプチル基、2-エチルプチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフエニル基、4-メチルフエニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフエニルメチル基、3-メチルフエニルメチル基、4-メチルフエニルメチル基、2,3-ジメチルフエニルメチル基、3,5-ジメチルフエニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2,3-ジフルオロフェニルメチル基、2,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,5-ジフルオロフェニルメチル基、3,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,3-ジクロロフェニルメチル基、2,4-ジクロロフェニルメチル基、2,5-ジクロロフェニルメチル基、2,6-ジクロロフェニルメチル基、3,4-ジクロロフェニルメチル基、3,5-ジクロロフェニルメチル基、3,6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフエニル)エチル基、2-(3-メチルフエニル)エチル基、2-(4-メチルフエニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)

ル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N,N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基を形成する。

ARはナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-

1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

### 【0283】

また本発明の特に好ましい別の態様は、一般式(I)で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3</sup>はARが結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup>はRsが結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup>はZ<sub>x</sub>で置換された炭素原子を示し、C<sup>2</sup>及びC<sup>6</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Z<sub>x</sub>はN-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N,N-ジメチルアミノ基、N,N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN,N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

Rsは-O-R<sub>x</sub>を示す。R<sub>x</sub>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-

フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

ARはナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-

オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基 Y は水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

#### 【0284】

さらにまた本発明の特に好ましい別の態様は、一般式 (I) で表される化合物又はその塩において以下の条件を全て満足する。

n は整数 2 を示す。

C<sup>3</sup> は A R が結合した炭素原子を示し、C<sup>4</sup> は R s が結合した炭素原子を示し、C<sup>5</sup> は V で置き換えられていてもよく、C<sup>2</sup> 及び C<sup>6</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

V は窒素原子を示すか、あるいは Z x で置換された炭素原子を示し、Z x は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は N, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。

R s は -O-R c を示す。R c 中の p は整数 2 を示し、A<sup>4</sup> は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup> は -C(O)-、-C(S)-、又は -S(O)<sub>2</sub>- を示す。R d はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、又は 4-フルオロフェニルメチル基の何れかの基を示す。R e はイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基の何れかの基を示す。

A R はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基

、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。

基Yは水素原子、メチル基、又はエチル基を示す。

#### 【0285】

本発明化合物(I)は置換基の種類により1個又は2個以上の不斉炭素を有する場合がある。例えばR<sub>s</sub>が不斉炭素を含む場合には、不斉炭素が1個の場合2種の光学異性体が存在し、不斉炭素が2個の場合には4種の光学異性体と2種類のジアステレオ異性体が存在する。光学異性体又はジアステレオ異性体などの純粋な形態の立体異性体、又は立体異性体の任意の混合物、ラセミ体などは、いずれも本発明の範囲に包含される。また、本発明化合物(I)はシクロアルキル環構造に基づく幾何異性体として存在する場合もあるが、純粋な形態の任意の幾何異性体又は幾何異性体の任意の混合物も本発明の範囲に包含される。ラセミ体などの混合物は製造の容易さの点から好ましい場合がある。

#### 【0286】



本発明化合物 (I) の塩としては、薬学上許容される塩が好ましい。例えば、(1) Y が水素原子のとき；(2) AR 中にカルボキシル基、フェノール性水酸基を含むとき；(3) Z<sub>x</sub> がフェノール性水酸基のときなど、(1) ~ (3) の一つ以上条件を満たす際は酸性基の数に応じて 1 ~ 3 個のアルカリ塩を形成することを意味する。アルカリ塩としては、例えばナトリウム、アンモニア等の無機塩基又はトリエチルアミン等の有機塩基との塩を挙げることができる。

#### 【0287】

また (1) R<sub>s</sub> が、置換された又は無置換のアミノ基を含む場合など、塩基の性質を持つとき；(2) AR 自体が塩基としての性質を持つ環状置換基であるとき；(3) AR 中に置換された又は無置換のアミノ基を含むとき；(4) 芳香環 (E) 中の何れかの炭素原子が V で置換され、V が窒素原子のとき、又は V が Z<sub>x</sub> で置換された炭素原子であり且つ Z<sub>x</sub> が置換された又は無置換のアミノ基のときなど、(1) ~ (4) の一つ以上条件を満たす際は塩基性基の数に応じて 1 ~ 4 個の酸性塩を形成することを意味する。酸性塩としては、例えば塩酸、硫酸等の無機酸又は酢酸、クエン酸等の有機酸との塩を挙げることができる。

#### 【0288】

前記一般式 (II) における芳香環 (E') 上の C<sup>2'</sup>、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>、及び C<sup>6'</sup> はそれぞれ環構成炭素原子を示す。それらのうちで R<sub>s'</sub> 又は G が結合していない何れか一つの環構成炭素原子は V' で置き換えられていてもよい。R<sub>s'</sub>、G、及び V' の置換位置については、前記一般式 (I) の R<sub>s</sub> (R<sub>s'</sub> の位置に相当)、AR (基 G の位置に相当) 及び V (V' の位置に相当) の置換位置の説明に準ずる。

V' は窒素原子を示すか、あるいは Z<sub>x'</sub> で置換された炭素原子を示す。Z<sub>x'</sub> は前述の Z<sub>x</sub> と同義であるが、ただし、Z<sub>x</sub> が水酸基 (OH) を含む場合には、その水酸基は R<sub>p</sub><sup>1</sup> で保護されていてもよく、Z<sub>x</sub> がアミノ基 (NH) を含む場合には、そのアミノ基は R<sub>p</sub><sup>2</sup> で保護されていてもよい。

R<sub>s'</sub> は -D-R<sub>x'</sub> 又は -N (R<sub>y'</sub>) (R<sub>z'</sub>) を表す。-D-R<sub>x'</sub> 及び -N (R<sub>y'</sub>) (R<sub>z'</sub>) はそれぞれ前述の -D-R<sub>x</sub> 及び -N (R<sub>y</sub>) (R<sub>z</sub>) と同義であるが、ただし -D-R<sub>x</sub> 及び -N (R<sub>y</sub>) (R<sub>z</sub>) が水酸基を含む場合には、その水酸基は R<sub>p</sub><sup>1</sup> で保護されていてもよく、また、-D-R<sub>x</sub> 及び -N (R<sub>y</sub>) (R<sub>z</sub>) がアミノ基 (NH) を含む場合には、そのアミノ基は R<sub>p</sub><sup>2</sup> で保護されていてもよい。

#### 【0289】

R<sub>p</sub><sup>1</sup> は例えば 3 個の同一又は相異なる炭素数 1 ~ 4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基あるいはフェニル基により置換されたシリル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロフリル基、アリル基、プロパルギル基、1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されていてもよいベンジル基、-CH<sub>2</sub>-U-R<sub>p3</sub>、-C (O) R<sub>p3</sub>、又は -C (O) O R<sub>p3</sub> などを表す。U は酸素原子又は硫黄原子を表し、R<sub>p3</sub> は水素原子、炭素数 1 ~ 4 個の直鎖状若しくは分枝状飽和アルキル基、トリメチルシリルエチル基、クロロメチル基、トリクロロメチル基、トリフルオロメチル基、9-フルオレニルメチル基、アダマンチル基、アリル基、又は -A<sup>6</sup>-Q<sub>p</sub> などを表す。R<sub>p</sub><sup>2</sup> は、例えば 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されていてもよいベンジル基、-C (O) R<sub>p3</sub>、又は -C (O) O R<sub>p3</sub> などを表す。但し水酸基及びアミノ基の保護基はこれらに限定されるものではなく、通常の化学文献、例えばプロテクティブ・グループ・イン・オーガニック・シンセシス第三版 (Protective Groups In Organic Synthesis THIRD EDITION) (John Wiley & Sons 社出版) あるいは当文献記載の参考文献などから保護基の導入、脱保護方法を参照し検討することで選択することができる。

#### 【0290】

G は塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、メシラート基、トリフラート基、又は芳香環部分が 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されていてもよいアレーンスルホネート基を表す。アレーンスルホネート基としては例えばベンゼンスルホネート基、p-

トルエンスルホネート基、メシチレンスルホネート基、2, 4, 6-トリイソプロピルベンゼンスルホネート基、4-フルオロベンゼンスルホネート基、2, 5-ジクロロベンゼンスルホネート基、3-(トリフルオロメチル)ベンゼンスルホネート基、ペンタフルオロベンゼンスルホネート基、2-ニトロベンゼンスルホネート基、又は2, 4-ジニトロベンゼンスルホネート基などが挙げられる。Gのうち好ましい例としては塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、又はトリフラート基などが挙げられ、臭素原子又はヨウ素原子は特に好ましい例である。

Y' は炭素数1~4個の低級アルキル基を表す。炭素数1~4個の低級アルキル基としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、又はt-ブチル基などが挙げられる。このうちメチル基又はエチル基は特に好ましい例である。前記一般式(II)におけるn及びDは前述のものと同義である。

#### 【0291】

一般式(II)で表される化合物のうち好ましい態様は以下の条件を全て満足する。

nは1~3の何れかの整数を示す。

基GはC<sup>2'</sup>に結合しており、R<sub>s</sub>'はC<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>あるいはC<sup>5'</sup>の何れかの原子に結合しており、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、又はC<sup>5'</sup>のうちR<sub>s</sub>'が結合していない環構成炭素原子はV'で置換されていてもよい。

V'は窒素原子又はZ<sub>x</sub>'で置換された炭素原子を示し、Z<sub>x</sub>'はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。但しZ<sub>x</sub>'が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Z<sub>x</sub>'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよい。

R<sub>s</sub>'は-D-R<sub>x</sub>'又は-N(R<sub>y</sub>')(R<sub>z</sub>')を示す。Dは酸素原子又はイオウ原子を示す。R<sub>x</sub>'はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基を示すか、あるいはR<sub>b</sub>又はR<sub>c</sub>を示す。R<sub>b</sub>中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。A<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-を示す(但しA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-N(メチル)-、又は-N(エチル)-を示すときA<sup>1</sup>はエチレンを示す)。R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す(但しQがフェニル基を示し、A<sup>1</sup>が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつA<sup>2</sup>が単結合を示すときには、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。R<sub>c</sub>中のpは整数2又は3を示し、A<sup>4</sup>は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup>は-C(O)-、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-を示す。R<sub>d</sub>は水素原子を示すか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。R<sub>e</sub>はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-

イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、*t*-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、*N*-メチルアミノ基、*N*, *N*-ジメチルアミノ基、*N*-エチルアミノ基、*N*, *N*-ジエチルアミノ基、*N*-プロピルアミノ基、*N*-イソプロピルアミノ基、*N*-ブチルアミノ基、*N*-イソブチルアミノ基、*N*-*t*-ブチルアミノ基、*N*-シクロプロピルアミノ基、*N*-シクロペンチルアミノ基、*N*-シクロヘキシルアミノ基、*N*-フェニルアミノ基、*N*-(4-メチルフェニル)アミノ基、*N*-(4-クロロフェニル)アミノ基、*N*-(4-フルオロフェニル)アミノ基、*N*-(ピリジン-2-イル)アミノ基、*N*-(ピリジン-3-イル)アミノ基、*N*-(ピリジン-4-イル)アミノ基、*N*-(フラン-2-イル)アミノ基、*N*-(フラン-3-イル)アミノ基、*N*-(チオフェン-2-イル)アミノ基、*N*-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。R<sub>2</sub>' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(*N*, *N*-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、

2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、N-*t*-ブチルカルバモイル基、N-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>' は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>' と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロールー1-イル基、イミダゾール-1-イル基又はピラゾール-1-イル基を形成する。但し-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') が水酸基(OH)を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよい。

基Gは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、又はトリフラート基を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

#### 【0292】

また一般式(I I)で表される化合物のうち好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは1~3の何れかの整数を示す。

基GはC<sup>3'</sup>に結合しており、R<sub>s</sub>' はC<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>、又はC<sup>6'</sup>の何れかの原子に結合しており、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>あるいはC<sup>6'</sup>のうちR<sub>s</sub>' が結合していない環構成炭素原子はV' で置き換えられていてもよい。

V' は窒素原子を示すか、あるいはZ<sub>x</sub>' で置換された炭素原子を示し、Z<sub>x</sub>' はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ

基、N、N-ジメチルアミノ基、N、N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又はN、N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。但しZx'が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Zx'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

R s' は-D-R x' 又は-N (R y') (R z') を示す。Dは酸素原子又はイオウ原子を示す。R x' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は2-シクロヘキシルエチル基を示すか、あるいはR b又はR cを示す。R b中のQはフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。A<sup>2</sup>は単結合、酸素原子、イオウ原子、-N (メチル)-、又は-N (エチル)-を示す (但しA<sup>2</sup>が酸素原子、イオウ原子、-N (メチル)-、又は-N (エチル)-を示すときA<sup>1</sup>はエチレンを示す)。R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す (但しQがフェニル基を示し、A<sup>1</sup>が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつA<sup>2</sup>が単結合を示すときには、R<sup>2</sup>又はR<sup>3</sup>のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。R c中のpは整数2又は3を示し、A<sup>4</sup>は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup>は-C (O)-、-C (S)-、又は-S (O)<sub>2</sub>-を示す。R dは水素原子を示すか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。R eはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、N-メチルアミノ基、N、N-ジメチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N、N-ジエチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、N-(ピリジン-2-イル)アミノ基、N-(ピリジン-3-イル)アミノ基、N-(ピリジン-4-イル)アミノ基、N-(フラン-2-イル)アミノ基、N-(フラン-3-イル)アミノ基、N-(チオフェン-2-イル)アミノ基、N-(チオフェン-3-イル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。R z' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2

ークロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、*t*-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、*t*-ブチルオキシカルボニル基、N-*t*-ブチルカルバモイル基、N-*t*-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル

基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。Ry' は水素原子、メチル基、エチル基又はイソブチル基を示すか、あるいはRz' と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基を形成しているものを示す。但し-D-Rx' 又は-N(Ry') (Rz') が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、-D-Rx' あるいは-N(Ry') (Rz') がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

基Gは塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、又はトリフラート基を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

### 【0293】

一般式(I I)で表される化合物のうち特に好ましい態様は以下の条件を全て満足する。

。

nは整数2を示す。

C<sup>2'</sup> は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>3'</sup> はRs' が結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はV' で置き換えられていてもよく、C<sup>5'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

。

V' は窒素原子を示すか、あるいはZx' で置換された炭素原子を示し、Zx' はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZx' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Zx' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

Rs' は-O-Rx' を示す。Rx' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニル

ルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y'はメチル基又はエチル基を示す。

#### 【0294】

また一般式(I I)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>2'</sup>は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup>はR<sup>s'</sup>が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup>はV'で置き換えられていてもよく、C<sup>3'</sup>及びC<sup>6'</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

V'は窒素原子又はZ<sup>x'</sup>で置換された炭素原子を示し、Z<sup>x'</sup>はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZ<sup>x'</sup>が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Z<sup>x'</sup>がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

R<sup>s'</sup>は-O-R<sup>x'</sup>を示す。R<sup>x'</sup>はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2



1-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y'はメチル基又はエチル基を示す。

#### 【0295】

さらに一般式(I I)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3'</sup>は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup>はR s'が結合した炭素原子を示し、C<sup>2'</sup>、C<sup>4'</sup>及びC<sup>6'</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

R s'は-O-R x'を示す。R x'はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2,

3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y'はメチル基又はエチル基を示す。

#### 【0296】

また一般式(I I)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3'</sup>は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup>はR s'が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup>は窒素原子を示し、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

R s'は-O-R x'を示す。R x'はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基

、4-（トリフルオロメチル）フェニルメチル基、2-（2-メチルフェニル）エチル基、2-（3-メチルフェニル）エチル基、2-（4-メチルフェニル）エチル基、2-（2-メトキシフェニル）エチル基、2-（3-メトキシフェニル）エチル基、2-（4-メトキシフェニル）エチル基、2-（2-フルオロフェニル）エチル基、2-（3-フルオロフェニル）エチル基、2-（4-フルオロフェニル）エチル基、2-（2-クロロフェニル）エチル基、2-（3-クロロフェニル）エチル基、2-（4-クロロフェニル）エチル基、2-〔2-（トリフルオロメチル）フェニル〕エチル基、2-〔3-（トリフルオロメチル）フェニル〕エチル基、2-〔4-（トリフルオロメチル）フェニル〕エチル基、2-〔4-（N,N-ジメチルアミノ）フェニル〕エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-（2-クロロフェニルオキシ）エチル基、2-（3-クロロフェニルオキシ）エチル基、2-（4-クロロフェニルオキシ）エチル基、2-（フェニルチオ）エチル基、2-（N-フェニル-N-メチルアミノ）エチル基又は2-（N-エチル-N-フェニルアミノ）エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

### 【0297】

さらに一般式（II）で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3'</sup> は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はR<sup>s'</sup> が結合した炭素原子を示し、C<sup>6'</sup> はZ<sup>x'</sup> で置換された炭素原子を示し、C<sup>2'</sup> 及びC<sup>5'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

Z<sup>x'</sup> はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN,N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZ<sup>x'</sup> が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Z<sup>x'</sup> がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

R<sup>s'</sup> は-O-R<sup>x'</sup>を示す。R<sup>x'</sup> はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4,7-ジメチルインダン-2-イル基、5,6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4,7-ジフルオロインダン-2-イル基、5,6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4,7-ジクロロインダン-2-イル基、5,6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4,7-ジメトキシインダン-2-イル基、5,6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-（2-フルオロフェニル）エチル基、1-（3-フルオロフェニル）エチル基、1-（4-フルオロフェニル）エチル基、1-（2-クロロフェニル）エチル基、1-（3-クロロフェニル）エチル基、1-（4-クロロフェニル）エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2,3-ジメチルフェニルメチル基、3,5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2,3-ジフルオロフェニルメチル基、2,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,5-ジフルオロフェニルメチル基、3,4-ジフルオロフェニルメチル基、2,3-ジクロロフェニルメチル基、2,4-ジクロロフェニルメチル基、2,5-ジクロロフェニルメチル基、2,6-ジクロロフェニルメチル基、3,4-ジクロロフェニルメチル基、3,5-ジクロロフェニルメチル基、3,6-ジクロロフェニルメチル基、2-（

トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、2-(4-メチルフェニル) エチル基、2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

### 【0298】

また一般式 (I I) で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3'</sup> は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はR<sup>s'</sup> が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup> はZ<sup>x'</sup> で置換されるか、又は無置換の炭素原子を示し、C<sup>2'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

Z<sup>x'</sup> はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZ<sup>x'</sup> が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Z<sup>x'</sup> がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

R<sup>s'</sup> は-S-R<sup>x'</sup>を示す。R<sup>x'</sup> は、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル) エチル基、1-(3-フルオロフェニル) エチル基、1-(4-フルオロフェニル) エチル基、1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、1-(4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、

チル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2- (2-メチルフェニル) エチル基、2- (3-メチルフェニル) エチル基、2- (4-メチルフェニル) エチル基、2- (2-メトキシフェニル) エチル基、2- (3-メトキシフェニル) エチル基、2- (4-メトキシフェニル) エチル基、2- (2-フルオロフェニル) エチル基、2- (3-フルオロフェニル) エチル基、2- (4-フルオロフェニル) エチル基、2- (2-クロロフェニル) エチル基、2- (3-クロロフェニル) エチル基、2- (4-クロロフェニル) エチル基、2- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [3- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [4- (N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2- フェニルオキシエチル基、2- (2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (フェニルチオ) エチル基、2- (N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2- (N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

### 【0299】

さらに一般式 (I I) で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3'</sup> は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はR s' が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup> はZ x' で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子を示し、C<sup>2'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

Z x' はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZ x' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR p<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Z x' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR p<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

R s' は-N (R y' ) (R z' ) を示す。R z' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1- (2-フルオロフェニル) エチル基、1- (3-フルオロフェニル) エチル基、1- (4-フルオロフェニル) エチル基、1- (2-クロロフェニル) エチル基、1- (3-クロロフェニル) エチル基、1- (4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2,

5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>' は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>' と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基を形成する。但し-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>1</sup>pで保護されていてもよく、また、R<sub>y</sub>' 又はR<sub>z</sub>' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>2</sup>pで保護されていてもよい。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

## 【0300】

また一般式 (I I) で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

$n$  は整数 2 を示す。

$C^{3'}$  は基  $G$  が結合した炭素原子を示し、 $C^{4'}$  は  $R s'$  が結合した炭素原子を示し、 $C^{5'}$  は  $Z x'$  で置換された炭素原子を示し、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  は無置換の環構成炭素原子を示す。

$Z x'$  は、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ ,  $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基又は  $N$ ,  $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。但し、置換  $Z x'$  がアミノ基 ( $NH$ ) を含む場合には、そのアミノ基は  $R p^2$  で保護されていてもよい。

$R s'$  は  $-O-R x'$  を示す。 $R x'$  はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-( $N$ ,  $N$ -ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-( $N$ -フェニル- $N$ -メチルアミノ)エチル基、又は2-( $N$ -エチル- $N$ -フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

### 【0301】

さらに一般式 (I I) で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

nは整数2を示す。

C<sup>3'</sup> は基Gが結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はR s' が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup> はZ x' で置換されるか、又は無置換の炭素原子を示し、C<sup>2'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

Z x' はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN、N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZ x' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR p<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Z x' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR p<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

R s' は-O-R x' を示す。R x' はR cと同義であり、ただしR cが水酸基(OH)を含む場合には、その水酸基はR p<sup>1</sup>で保護されていてもよい。R c中のpは整数2を示し、A<sup>4</sup>は単結合又はメチレンを示す。A<sup>5</sup>は-C(O)-、-C(S)-、又は-S(O)<sub>2</sub>-を示す。R dはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、又は4-フルオロフェニルメチル基の何れかの基を示す。R eはイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、t-ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、t-ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-t-ブチルアミノ基、N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基、N-フェニルアミノ基、N-(4-メチルフェニル)アミノ基、N-(4-クロロフェニル)アミノ基、N-(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基の何れかの基を示す。

基Gは臭素原子又はヨウ素原子を示す。

基Y' はメチル基又はエチル基を示す。

### 【0302】

前記一般式 (I I I) 芳香環 (E') 上のC<sup>2'</sup>、C<sup>3'</sup>、C<sup>4'</sup>、C<sup>5'</sup>、及びC<sup>6'</sup>はそれぞれ環構成炭素原子を示す。それらのうちでR s' 又はAR' が結合していない何れか一つの環構成炭素原子はV' で置き換えられていてもよい。R s'、AR'、及びV'の置換位置については、前記一般式 (I) のR s (R s' の位置に相当)、AR (AR' の位置に相当) 及びV (V' の位置に相当) の置換位置の説明に準ずる。

AR' は前述のARと同義であり、ただしARが水酸基を含む場合には、その水酸基はR p<sup>1</sup>で保護されていてもよい。この場合、水酸基としては、カルボキシ基(COOH)中のOHも含まれる。また、置換ARがアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR p<sup>2</sup>で保護されてもよい置換基を表す。保護されてもよいアミノ基としては、ARを構成する環が例えばインドール環やインダゾール環などのように環中にNHが存在する場合、このNHも含まれる。

前記一般式 (I I I) におけるR s'、V'、n、及びDは前述のものと同義である。また、R p<sup>1</sup>、R p<sup>2</sup>についても前述のものと同義である。

### 【0303】



一般式 (I I I) で表される化合物のうち好ましい態様は以下の条件を全て満足する。  
 $AR'$  は  $C^{2'}$  に結合しており、 $Rs'$  は  $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は  $C^{5'}$  の何れかの原子に結合しており、 $C^{3'}$ 、 $C^{4'}$ 、又は  $C^{5'}$  のうち  $Rs'$  が結合していない環構成炭素原子は  $V'$  で置き換えられていてもよい。

$V'$  は窒素原子を示すか、あるいは  $Zx'$  で置換された炭素原子を示し、 $Zx'$  はフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。但し  $Zx'$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $Rp^1$  で保護されていてもよく、また、置換  $Zx'$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $Rp^2$  で保護されていてもよい。

$Rs'$  は  $-D-Rx'$  又は  $-N(Ry')(Rz')$  を示す。 $D$  は酸素原子又はイオウ原子を示す。 $Rx'$  はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、2-シクロヘキシルエチル基あるいは  $Rb$  又は  $Rc$  を示す。 $Rb$  中の  $Q$  はフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。 $A^2$  は単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  を示す (但し  $A^2$  が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  を示すとき  $A^1$  はエチレンを示す)。 $R^2$  及び  $R^3$  はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す (但し  $Q$  がフェニル基を示し、 $A^1$  が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつ  $A^2$  が単結合を示すときには、 $R^2$  又は  $R^3$  のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。 $Rc$  中の  $p$  は整数2又は3を示し、 $A^4$  は単結合又はメチレンを示す。 $A^5$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は  $-S(O)_2-$  を示す。 $Rd$  は水素原子を示すか、あるいはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ペンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。 $Re$  はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-フルオロフェニル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-2-イル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-3-イル)アミノ基、 $N$ -(ピリジン-4-イル)アミノ基、

N- (フラン-2-イル) アミノ基、N- (フラン-3-イル) アミノ基、N- (チオフェン-2-イル) アミノ基、N- (チオフェン-3-イル) アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。R<sub>2</sub>' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1- (2-フルオロフェニル) エチル基、1- (3-フルオロフェニル) エチル基、1- (4-フルオロフェニル) エチル基、1- (2-クロロフェニル) エチル基、1- (3-クロロフェニル) エチル基、1- (4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2- (2-メチルフェニル) エチル基、2- (3-メチルフェニル) エチル基、2- (4-メチルフェニル) エチル基、2- (2-メトキシフェニル) エチル基、2- (3-メトキシフェニル) エチル基、2- (4-メトキシフェニル) エチル基、2- (2-フルオロフェニル) エチル基、2- (3-フルオロフェニル) エチル基、2- (4-フルオロフェニル) エチル基、2- (2-クロロフェニル) エチル基、2- (3-クロロフェニル) エチル基、2- (4-クロロフェニル) エチル基、2- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [3- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [4- (N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2- (2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (フェニルチオ) エチル基、2- (N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、2- (N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチルフェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、

4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>' は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>' と繋がってそれらが結合する窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基を形成する。但し-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup> で保護されていてもよく、また、-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup> で保護されていてもよい。

AR' はナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ

[3, 2-b] ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b] ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5] チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5] チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b] ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b] ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8] ナフタリジン-3-イル基、[1, 8] ナフタリジン-4-イル基、[1, 5] ナフタリジン-3-イル基、[1, 5] ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c] ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c] ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b] ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c] ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c] ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4] トリアゾロ[4, 3-a] ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c] ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c] ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c] ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b] ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b] ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b] ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b] ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c] ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c] ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d] イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c] イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d] チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4] トリアゾロ[1, 5-a] ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b] ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b] ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基（上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sup>a</sup>で置換されていてもよい）の何れかを示す。置換基X<sup>a</sup>はオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。但しAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

## 【0304】

また一般式 (I I I) で表される化合物のうち好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

$AR'$  は  $C^{3'}$  に結合しており、 $Rs'$  は  $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、又は  $C^{6'}$  の何れかの環構成炭素原子に結合しており、 $C^{4'}$ 、 $C^{5'}$ 、又は  $C^{6'}$  のうち  $Rs'$  が結合していない環構成炭素原子は  $V'$  で置き換えられていてもよい。

$V'$  は窒素原子を示すか、あるいは  $Zx'$  で置換された炭素原子を示し、 $Zx'$  は、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ニトロ基、メチル基、水酸基、メトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基、又は  $N$ 、 $N$ -ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。但し  $Zx'$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $Rp^1$  で保護されていてもよく、また、置換  $Zx'$  がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基は  $Rp^2$  で保護されていてもよい。

$Rs'$  は  $-D-Rx'$  又は  $-N(Ry')(Rz')$  を示す。 $D$  は酸素原子又はイオウ原子を示す。 $Rx'$  はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、又は 2-シクロヘキシルエチル基を示すか、あるいは  $Rb$  又は  $Rc$  を示す。 $Rb$  中の  $Q$  はフェニル基、チエニル基、フリル基、ピリジル基、オキサゾリル基、ナフチル基、テトラヒドロナフチル基、インダニル基、インドリル基、又はジヒドロベンゾジオキシル基の何れかの基を示す。 $A^2$  は単結合、酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、又は  $-N$  (エチル)  $-$  を示す (但し  $A^2$  が酸素原子、イオウ原子、 $-N$  (メチル)  $-$ 、 $-N$  (エチル)  $-$  を示すとき  $A^1$  はエチレンを示す)。 $R^2$  及び  $R^3$  はそれぞれ独立に水素原子、メチル基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メトキシ基、ジメチルアミノ基、アセチルアミノ基、又はメチルスルホニルアミノ基を示す (但し  $Q$  がフェニル基を示し、 $A^1$  が単結合を示すか又は無置換のメチレンを示し、かつ  $A^2$  が単結合を示すときには、 $R^2$  又は  $R^3$  のどちらか一方は水素原子以外の置換基を示す)。 $Rc$  中の  $p$  は整数 2 又は 3 を示し、 $A^4$  は単結合又はメチレンを示す。 $A^5$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$  又は  $-S(O)_2-$  を示す。 $Rd$  は水素原子若しくはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロプロピルメチル基、シクロペンチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、又はピリジン-4-イル基の何れかの基を示す。 $Re$  はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、フェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-3-イル基、ピリジン-4-イル基、フラン-2-イル基、フラン-3-イル基、チオフェン-2-イル基、チオフェン-3-イル基、メトキシ基、エトキシ基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、チオメトキシ基、アミノ基、 $N$ -メチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジメチルアミノ基、 $N$ -エチルアミノ基、 $N$ 、 $N$ -ジエチルアミノ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)

ル) アミノ基、N-(4-フルオロフェニル) アミノ基、N-(ピリジン-2-イル) アミノ基、N-(ピリジン-3-イル) アミノ基、N-(ピリジン-4-イル) アミノ基、N-(フラン-2-イル) アミノ基、N-(フラン-3-イル) アミノ基、N-(チオフェン-2-イル) アミノ基、N-(チオフェン-3-イル) アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モルホリノ基、メチルオキシカルボニルアミノ基、又はエチルオキシカルボニルアミノ基の何れかの基を示す。R<sub>2</sub>' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル) エチル基、1-(3-フルオロフェニル) エチル基、1-(4-フルオロフェニル) エチル基、1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、1-(4-クロロフェニル) エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、2-(4-メチルフェニル) エチル基、2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基、イソブチリル基、イソプロピルチオカルボニル基、イソプロピルスルホニル基、バレリル基、ブチルチオカルボニル基、イソバレリル基、イソブチルチオカルボニル基、ピバロイル基、t-ブチルチオカルボニル基、シクロプロピルカルボニル基、シクロプロピルチオカルボニル基、シクロペンチルカルボニル基、シクロペンチルチオカルボニル基、シクロヘキシルカルボニル基、シクロヘキシルチオカルボニル基、シクロペンチルメチルカルボニル基、シクロペンチルメチルチオカルボニル基、シクロヘキシルメチルカルボニル基、シクロヘキシルメチルチオカルボニル基、ベンゾイル基、チオベンゾイル基、フェニルスルホニル基、4-メチルフェニルカルボニル基、4-メチル

フェニルチオカルボニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルカルボニル基、4-クロロフェニルチオカルボニル基、4-フルオロフェニルカルボニル基、4-フルオロフェニルチオカルボニル基、イソプロピルオキシカルボニル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、ブチルオキシカルボニル基、N-ブチルカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、イソブチルオキシカルボニル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、t-ブチルオキシカルボニル基、N-t-ブチルカルバモイル基、N-t-ブチルチオカルバモイル基、シクロプロピルオキシカルボニル基、N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロプロピルチオカルバモイル基、シクロペンチルオキシカルボニル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロペンチルチオカルバモイル基、シクロヘキシルオキシカルボニル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロヘキシルチオカルバモイル基、シクロペンチルメチルオキシカルボニル基、シクロヘキシルメチルオキシカルボニル基、フェニルオキシカルボニル基、N-フェニルカルバモイル基、N-フェニルチオカルバモイル基、4-メチルフェニルオキシカルボニル基、N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)チオカルバモイル基、4-クロロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)チオカルバモイル基、4-フルオロフェニルオキシカルボニル基、N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)チオカルバモイル基、(ピロリジノー1-イル)カルボニル基、(ピペリジノー1-イル)カルボニル基、又は(モルホリノー4-イル)カルボニル基の何れかの基を示す。R<sub>y</sub>' は水素原子、メチル基、エチル基、又はイソブチル基を示すか、あるいはR<sub>z</sub>' と繋がって窒素原子とともにピロリジノ基、ピペリジノ基、ピペラジノ基、モルホリノ基、ピロール-1-イル基、イミダゾール-1-イル基、又はピラゾール-1-イル基を形成しているものを示す。但し-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub><sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、-D-R<sub>x</sub>' 又は-N(R<sub>y</sub>') (R<sub>z</sub>') がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sub>p</sub><sup>2</sup>で保護されていてもよい。

AR' はナフタレン-2-イル基、ナフタレン-1-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベンゾフラン-4-イル基、ベンゾフラン-2-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-4-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-2-イル基、インドール-5-イル基、インドール-4-イル基、インドール-6-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾチアゾール-4-イル基、キノリン-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-5-イル基、キノリン-7-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-6-イル基、ジヒドロ-1H-キノリン-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-7-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1H-インダゾール-4-イル基、1H-インダゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソチアゾール-7-イル基、2H-インダゾール-5-イル基、2H-インダゾール-4-イル基、2H-インダゾール-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-7-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、イソキノリン-6-イル基、イソキノリン-3-イル基、イソキノリン-5-イル基、イソキノリン-7-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-6-イル基、ジヒドロ-2H-イソキノリン-5-イル基、シンノリン-6-イル基、シンノリン-5-イル基、キナゾリン-6-イル基、キナゾリン-7-イル基、キナゾリン-5-イル基、キノキサリン-2-イル基、キノキサリン-6-イル基、キノキサリン-5-イル基、1H-ベンゾイミダゾール-5-イル基、1H-ベンゾイミダ

ゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-5-イル基、ベンゾ[1, 2, 5]チアジアゾール-4-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-5-イル基、1H-ベンゾトリアゾール-4-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1, 3-ジヒドロピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-5-イル基、1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-4-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-6-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-7-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-5-イル基、ジヒドロ-3H-ベンゾオキサゾール-4-イル基、フタラジン-6-イル基、フタラジン-5-イル基、[1, 8]ナフタリジン-3-イル基、[1, 8]ナフタリジン-4-イル基、[1, 5]ナフタリジン-3-イル基、[1, 5]ナフタリジン-4-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[3, 2-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピロロ[2, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-b]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[4, 3-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-c]ピリジン-4-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-5-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピリジン-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-6-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[4, 3-a]ピリジン-7-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-c]ピリジン-6-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-2-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-3-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-5-イル基、チエノ[3, 2-b]ピリジン-6-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-5-イル基、1H-チエノ[3, 2-c]ピラゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[d]イソオキサゾール-7-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-5-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-4-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-6-イル基、ベンゾ[c]イソオキサゾール-7-イル基、インドリジン-7-イル基、インドリジン-6-イル基、インドリジン-8-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-5-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-4-イル基、1, 3-ジヒドロインドール-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-d]チアゾール-5-イル基、2H-イソインドール-5-イル基、2H-イソインドール-4-イル基、[1, 2, 4]トリアゾロ[1, 5-a]ピリミジン-6-イル基、1H-ピラゾロ[3, 4-b]ピラジン-5-イル基、1H-イミダゾ[4, 5-b]ピラジン-5-イル基、7H-プリン-2-イル基、4H-クロメン-6-イル基、又は4H-クロメン-5-イル基(上記の基は1個又は同一若しくは異なる2個以上のX<sub>a</sub>で置換されていてもよい)の何れかを示す。置換基X<sub>a</sub>はオキシ基、チオキシ基、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、メチル基、エチル基、プロピル基、2-ヒドロキシエチル基、カルボキシメチル基、2-カルボキシエチル基、N, N-ジメチルカルバモイルメチル基、水酸基、メトキシ基、2-ヒドロキシエチルオキシ基、カルボキシメチルオキシ基、2-カルボキシエチルオキシ基、N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ基、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、2-ヒドロキシエチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、アセチルアミノ基、フラン-2-カルボキシアミノ基、2-ヒドロキシアセチルアミノ基、2-アミノアセチルアミノ基、メチルスルホニルアミノ基、(N, N-ジメチルスルファモイル)アミノ基、メタンスルホニル基、スルファモイル基、N-メチルスルファモイル基、N, N-ジメチルスルファモイル基、カルボキシ基、アセチル基、カルバモイル基、又はN, N-ジメチルカルバモイル基の何れかの基を示す。但しAR'が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sub>p</sub>



<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

【0305】

一般式 (III) で表される化合物のうち特に好ましい態様は以下の条件を全て満足する。

C<sup>2'</sup> はAR' が結合した炭素原子を示し、C<sup>3'</sup> はRs' が結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はV' で置き換えられていてもよく、C<sup>5'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

V' は窒素原子を示すか、あるいはZx' で置換された炭素原子を示し、Zx' はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZx' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Zx' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

Rs' は-O-Rx' を示す。Rx' は、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N

ーフェニルアミノ) エチル基の何れかの基を示す。

AR' はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

#### 【0306】

また一般式(III)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

C<sup>2'</sup> はAR' が結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はRs' が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup> はV' で置き換えられていてもよく、C<sup>3'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

V' は窒素原子を示すか、あるいはZx' で置換された炭素原子を示し、Zx' はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但し、Zx' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Zx' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

Rs' は-O-Rx' を示す。Rx' は、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

AR' はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-

ーメチルベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ〔b〕チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ〔d〕イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

#### 【0307】

さらに一般式(I I I)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

C<sup>3'</sup> はAR' が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup> はR<sup>s'</sup> が結合した炭素原子を示し、C<sup>2'</sup>、C<sup>4'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

R<sup>s'</sup> は-O-R<sup>x'</sup>を示す。R<sup>x'</sup>は、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロイ

ンダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

AR' はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-

イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

#### 【0308】

また一般式 (I I) で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

C<sup>3'</sup> はAR' が結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はR<sup>s'</sup> が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup> は窒素原子を示し、C<sup>2'</sup> 及びC<sup>6'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

R<sup>s'</sup> は-O-R<sup>x'</sup> を示す。R<sup>x'</sup> は、ブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 6-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、

チル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、3- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、4- (トリフルオロメチル) フェニルメチル基、2- (2-メチルフェニル) エチル基、2- (3-メチルフェニル) エチル基、2- (4-メチルフェニル) エチル基、2- (2-メトキシフェニル) エチル基、2- (3-メトキシフェニル) エチル基、2- (4-メトキシフェニル) エチル基、2- (2-フルオロフェニル) エチル基、2- (3-フルオロフェニル) エチル基、2- (4-フルオロフェニル) エチル基、2- (2-クロロフェニル) エチル基、2- (3-クロロフェニル) エチル基、2- (4-クロロフェニル) エチル基、2- [2- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [3- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2- [4- (N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2- (2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2- (フェニルチオ) エチル基、2- (N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2- (N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基の何れかの基を示す。

AR' は、ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6- (2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6- (N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6- (N, N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6- (2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ [b] フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ [b] フラン-5-イル基、ベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ [b] チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1- (2-ヒドロキシエチル) -1H-インドール-5-イル基、1- (2-ヒドロキシエチル) -2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1- (2-ヒドロキシエチル) -3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1- (2-ヒドロキシエチル) -1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ [d] イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1- (2-ヒドロキシエチル) -1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ [1, 2-a] ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ [2, 3-b] ピリジン-5-イル基

、1-メチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ〔2, 3-b〕ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

### 【0309】

さらに一般式(III)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

C<sup>3'</sup> はAR' が結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup> はRs' が結合した炭素原子を示し、C<sup>6'</sup> はZx' で置換された炭素原子を示し、C<sup>2'</sup> 及びC<sup>5'</sup> は無置換の環構成炭素原子を示す。

Zx' はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN, N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZx' が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Zx' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

Rs' は-O-Rx' を示す。Rx' はブチル基、イソブチル基、2-エチルブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフ



ルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル) フェニル] エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ) フェニル] エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルチオ) エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ) エチル基、又は2-(N-エチル-N-フェニルアミノ) エチル基の何れかの基を示す。

AR' はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ) ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(N, N-ジメチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ) ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1, 2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR' が水酸基を含む場合には、その水酸基はR<sup>p1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR' がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はR<sup>p2</sup>で保護されていてもよい。

【0310】

また一般式 (I I I) で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

$C^{3'}$  は  $AR'$  が結合した炭素原子を示し、 $C^{4'}$  は  $Rs'$  が結合した炭素原子を示し、 $C^{5'}$  は  $Zx'$  で置換された炭素原子を示し、 $C^{2'}$  及び  $C^{6'}$  は無置換の環構成炭素原子を示す。

$Zx'$  は N-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、ホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、カルバモイルアミノ基、メシルアミノ基又は N, N-ジメチルスルファモイルアミノ基の何れかの基を示す。但し置換  $Zx'$  がアミノ基 (NH) を含む場合には、そのアミノ基は  $Rp^2$  で保護されていてもよい。

$Rs'$  は  $-O-Rx'$  を示す。 $Rx'$  は プチル基、イソプチル基、2-エチルプチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、2-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、インダン-2-イル基、4-メチルインダン-2-イル基、5-メチルインダン-2-イル基、4, 7-ジメチルインダン-2-イル基、5, 6-ジメチルインダン-2-イル基、4-フルオロインダン-2-イル基、5-フルオロインダン-2-イル基、4, 7-ジフルオロインダン-2-イル基、5, 6-ジフルオロインダン-2-イル基、4-クロロインダン-2-イル基、5-クロロインダン-2-イル基、4, 7-ジクロロインダン-2-イル基、5, 6-ジクロロインダン-2-イル基、4-メトキシインダン-2-イル基、5-メトキシインダン-2-イル基、4, 7-ジメトキシインダン-2-イル基、5, 6-ジメトキシインダン-2-イル基、1-フェニルエチル基、1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、2-メチルフェニルメチル基、3-メチルフェニルメチル基、4-メチルフェニルメチル基、2, 3-ジメチルフェニルメチル基、3, 5-ジメチルフェニルメチル基、2-フルオロフェニルメチル基、3-フルオロフェニルメチル基、4-フルオロフェニルメチル基、2-クロロフェニルメチル基、3-クロロフェニルメチル基、4-クロロフェニルメチル基、2, 3-ジフルオロフェニルメチル基、2, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 5-ジフルオロフェニルメチル基、3, 4-ジフルオロフェニルメチル基、2, 3-ジクロロフェニルメチル基、2, 4-ジクロロフェニルメチル基、2, 5-ジクロロフェニルメチル基、2, 6-ジクロロフェニルメチル基、3, 4-ジクロロフェニルメチル基、3, 5-ジクロロフェニルメチル基、3, 6-ジクロロフェニルメチル基、2-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、3-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、4-(トリフルオロメチル)フェニルメチル基、2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、2-(4-メチルフェニル)エチル基、2-(2-メトキシフェニル)エチル基、2-(3-メトキシフェニル)エチル基、2-(4-メトキシフェニル)エチル基、2-(2-フルオロフェニル)エチル基、2-(3-フルオロフェニル)エチル基、2-(4-フルオロフェニル)エチル基、2-(2-クロロフェニル)エチル基、2-(3-クロロフェニル)エチル基、2-(4-クロロフェニル)エチル基、2-[2-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]エチル基、2-[4-(N, N-ジメチルアミノ)フェニル]エチル基、2-フェニルオキシエチル基、2-(2-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(3-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(4-クロロフェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルチオ)エチル基、2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)エチル基、又は 2-(N-エチル-N-フェニルアミノ)エチル基の何れかの基を示す。

$AR'$  は ナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル

基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-(N-メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(N,N-ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[b]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]フラン-5-イル基、ベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、2,3-ジメチルベンゾ[b]チオフェン-5-イル基、1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-メチル-1H-インドール-5-イル基、1,2-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1,2,3-トリメチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-エチル-2,3-ジメチル-1H-インドール-5-イル基、1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-プロピル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1H-インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1H-インドール-5-イル基、2,3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1,2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[d]イソチアゾール-5-イル基、1H-インダゾール-5-イル基、1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、1-エチル-3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR'が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

#### 【0311】

さらに一般式(III)で表される化合物のうち特に好ましい別の態様は以下の条件を全て満足する。

C<sup>3'</sup>はAR'が結合した炭素原子を示し、C<sup>4'</sup>はRs'が結合した炭素原子を示し、C<sup>5'</sup>はZx'で置換されるか、又は無置換の環構成炭素原子を示し、C<sup>2'</sup>及びC<sup>6'</sup>は無置換の環構成炭素原子を示す。

Zx'はフッ素原子、メチル基、水酸基、アミノ基、N-メチルアミノ基、又はN,N-ジメチルアミノ基の何れかの基を示す。但しZx'が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換Zx'がアミノ基を含む場合には、そのア

ミノ基は  $R p^2$  で保護されていてもよい。

$R s'$  は  $-O-R x'$  を示す。 $R x'$  は、 $R c$  と同義であり、ただし  $R c$  が水酸基を含む場合には、その水酸基は  $R p^1$  で保護されていてもよい。 $R c$  中の  $p$  は整数2を示し、 $A^4$  は単結合又はメチレンを示す。 $A^5$  は  $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、又は  $-S(O)_2-$  を示す。 $R d$  はメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、ベンジル基、4-クロロフェニルメチル基又は4-フルオロフェニルメチル基の何れかの基を示す。 $R e$  はイソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、 $t$ -ブチル基、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロペンチルメチル基、シクロヘキシルメチル基、フェニル基、4-メチルフェニル基、4-クロロフェニル基、4-フルオロフェニル基、プロピルオキシ基、イソプロピルオキシ基、ブチルオキシ基、イソブチルオキシ基、 $t$ -ブチルオキシ基、シクロプロピルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシルオキシ基、シクロペンチルメチルオキシ基、シクロヘキシルメチルオキシ基、フェニルオキシ基、4-メチルフェニルオキシ基、4-クロロフェニルオキシ基、4-フルオロフェニルオキシ基、 $N$ -プロピルアミノ基、 $N$ -イソプロピルアミノ基、 $N$ -ブチルアミノ基、 $N$ -イソブチルアミノ基、 $N$ - $t$ -ブチルアミノ基、 $N$ -シクロプロピルアミノ基、 $N$ -シクロペンチルアミノ基、 $N$ -シクロヘキシルアミノ基、 $N$ -フェニルアミノ基、 $N$ -(4-メチルフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-クロロフェニル)アミノ基、 $N$ -(4-フルオロフェニル)アミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、又はモルホリノ基の何れかの基を示す。

$A R'$  はナフタレン-2-イル基、6-ヒドロキシナフタレン-2-イル基、6-メトキシナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルオキシ)ナフタレン-2-イル基、6-アミノナフタレン-2-イル基、6-( $N$ -メチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-( $N$ ,  $N$ -ジメチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、6-(2-ヒドロキシエチルアミノ)ナフタレン-2-イル基、ベンゾ[ $b$ ]フラン-5-イル基、2-メチルベンゾ[ $b$ ]フラン-5-イル基、3-メチルベンゾ[ $b$ ]フラン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[ $b$ ]フラン-5-イル基、ベンゾ[ $b$ ]チオフェン-5-イル基、2-メチルベンゾ[ $b$ ]チオフェン-5-イル基、3-メチルベンゾ[ $b$ ]チオフェン-5-イル基、2, 3-ジメチルベンゾ[ $b$ ]チオフェン-5-イル基、1 $H$ -インドール-5-イル基、2-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、3-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1, 2-ジメチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1, 3-ジメチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1, 2, 3-トリメチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-エチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-エチル-2-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-エチル-3-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-エチル-2, 3-ジメチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-プロピル-1 $H$ -インドール-5-イル基、2-メチル-1-プロピル-1 $H$ -インドール-5-イル基、3-メチル-1-プロピル-1 $H$ -インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-プロピル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-3-メチル-1 $H$ -インドール-5-イル基、2, 3-ジメチル-1-(2-ヒドロキシエチル)-1 $H$ -インドール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、2-メチルベンゾチアゾール-6-イル基、2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル基、2-アミノベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-オキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、2-チオキソ-3-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル基、キノリン-3-イル基、キノリン-6-イル基、2-オキソ-1, 2-ジヒドロキノリン-6-イル基、ベンゾ[ $d$ ]イソチアゾール-5-イル基、1 $H$ -インダゾール-5-イル基、1-エチル-

1H-インダゾール-5-イル基、1-プロピル-1H-インダゾール-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1H-インダゾール-5-イル基、3-ヒドロキシ-1-メチル-1H-インダゾール-5-イル基、イミダゾ[1,2-a]ピリジン-6-イル基、1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-メチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-エチル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-プロピル-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-ピロロ[2,3-b]ピリジン-5-イル基、イソキノリン-6-イル基、1-オキソ-1,2-ジヒドロイソキノリン-6-イル基、シンノリン-6-イル基、又はベンゾオキサゾール-5-イル基の何れかの基を示す。但しAR'が水酸基を含む場合には、その水酸基はRp<sup>1</sup>で保護されていてもよく、また、置換AR'がアミノ基を含む場合には、そのアミノ基はRp<sup>2</sup>で保護されていてもよい。

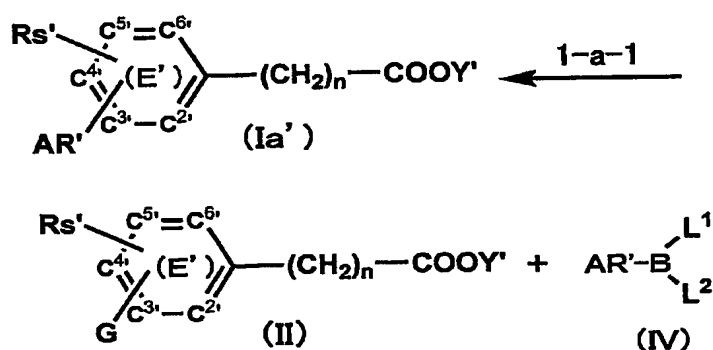
## 【0312】

本発明化合物(I)は、たとえば、下記の諸方法の反応を用いて製造することができる。

〔製造法1〕(工程a-1)次Scheme1:

## 【0313】

## 【化6】



(Scheme1)

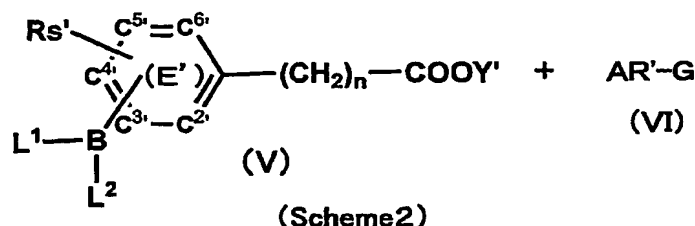
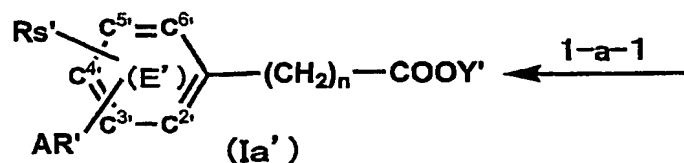
で表されるごとく、本発明化合物(I)の一部であって、そのYが炭素数1~4個の低級アルキル基を示し、Rs、AR、及び芳香環(E)上のVが保護されていてもよい、一般式(Ia')で表される化合物〔以下、単に「化合物(Ia')」と称する〕は、一般式(II)で表される化合物〔以下、単に「化合物(II)」と称する〕と一般式(IV)で表されるボロン酸誘導体〔以下、単に「化合物(IV)」と称する〕と反応せしめることで製造することができる。式中のn、C<sup>2'</sup>~C<sup>6'</sup>、Rs'、AR'、Y'及びGは前記と同義である。また化合物(IV)の式中、L<sup>1</sup>及びL<sup>2</sup>はそれぞれ独立に水酸基、炭素数1ないし8個のアルコキシ基(たとえばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、シクロヘキシルオキシ基)、又は置換若しくは無置換フェニルオキシ基を示すか、あるいはL<sup>1</sup>とL<sup>2</sup>とが互いに結合してホウ素原子を含む環〔この環は飽和又は不飽和どちらでもよく、ホウ素以外のヘテロ原子(たとえば酸素原子)を含む環であってもよく、またこれらの環上はさらに置換されていてもよい〕を形成したアリールホウ酸の5又は6員環環状エステル(たとえば9-ボラビシクロ[3,3,1]ノナン、1,3,2-ジオキサボロラン、4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン)を示す。

## 【0314】

また次Scheme2:

## 【0315】

## 【化 7】



で表されるごとく、化合物 (Ia') の製造方法としては、一般式 (V) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (V)」と称する〕と一般式 (VI) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (VI)」と称する〕との組み合わせで反応せしめる方法も挙げられる。

## 【0316】

すなわち Scheme 1 及び Scheme 2 で表される双方あるいはいずれかの組み合わせで、たとえば第 4 版実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、25 巻、403 頁に記載の Suzuki 反応を行うことにより化合物 (Ia') を製造することが例として挙げられる。具体的な例としては化合物 (II) [あるいは化合物 (V)] を溶媒中、市販のパラジウム触媒又はパラジウム錯体と配位子とから調製される触媒及び塩基の存在下、化合物 (IV) [あるいは化合物 (VI)] と反応することが挙げられる。

## 【0317】

パラジウム触媒は、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム、テトラキス (メチルジフェニルホスフィン) パラジウム、ジクロロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム、ジクロロビス (トリ-*o*-トリルホスフィン) パラジウム、ジクロロビス (トリシクロヘキシルホスフィン) パラジウム、ジクロロビス (トリエチルホスフィン) パラジウム、酢酸パラジウム、塩化パラジウム、塩化ビス (アセトニトリル) パラジウム、トリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウム、塩化ビス (ジフェニルホスフィノフェロセン) パラジウムなど市販されている触媒を購入してそのまま反応系に加えてもよいし、酢酸パラジウムやトリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウムなどと任意の配位子から別途調製、単離した触媒を加えてもよい。また、酢酸パラジウムやトリス (ジベンジリデンアセトン) ジパラジウムなどと任意の配位子を混合することによって反応系中で実際に反応に関与すると考えられる触媒を調製してもよい。パラジウムの価数は 0 であっても +2 であってもよい。配位子としては、トリフェニルホスフィン、トリ (*o*-トリル) ホスフィン、トリ (シクロヘキシル) ホスフィン、トリ (*t*-ブチル) ホスフィン、ジシクロヘキシルフェニルホスフィン、1, 1'-ビス (ジ-*t*-ブチルホスフィノ) フェロセン、2-ジシクロヘキシルホスフィノ-2'-ジメチルアミノ-1, 1'-ビフェニル、2- (ジ-*t*-ブチルホスフィノ) ビフェニルなどのホスフィン配位子及びイミダゾール-2-イリデンカルベン類などのホスフィンミミック配位子などが例示される。用いるパラジウム触媒の当量数は、等量であっても触媒量であってもよいが、0.01~20.0 mol % が好ましく、特に 0.10~10.0 mol % がより好ましい。

## 【0318】

塩基としては炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、フッ化セシウム、フッ化カリウム、リン酸カリウム、酢酸カリウム、トリエチルアミン、水酸化カリウム、水酸化ナトリウム、ナトリウムメトキシド、リチウムメトキシドなどを用いることが例示される。反応温度は、20℃から 150℃までの間が好ましく、特に好ましくは、20℃から 1

20℃の間が例示される。

【0319】

反応系としては、水-有機溶媒の2相系、含水有機溶媒あるいは有機溶媒の均一系いずれであってもよい。有機溶媒としては、トルエン、キシレン、ヘキサンなどの炭化水素系溶媒、塩化メチレンなどのハロゲン系溶媒、ジメチルスルホキシドなどのスルホキシド系溶媒、ジメチルホルムアミドなどのアミド系溶媒、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジグライムなどのエーテル系溶媒、メタノール、エタノールなどのアルコール系溶媒、アセトニトリルなどのニトリル系溶媒、アセトン、シクロヘキサノンなどのケトン系溶媒、酢酸エチルなどのエステル系溶媒、ピリジンなどのヘテロ環系溶媒などを用いることが例示される。また、2種類以上の有機溶媒を混合して用いてもよい。

【0320】

反応条件については、宮浦憲夫、鈴木章、ケミカル・レビュー (Chemical Review)、1995年、95巻、2457頁及びスニーカス (V. Snieckus)、ケミカル・レビュー (Chemical Review)、1990年、90巻、879頁などやこれら文献記載の参考文献を参照することができる。

基AR'、Rs' あるいは芳香環(E') 中のV' 中に、上記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

【0321】

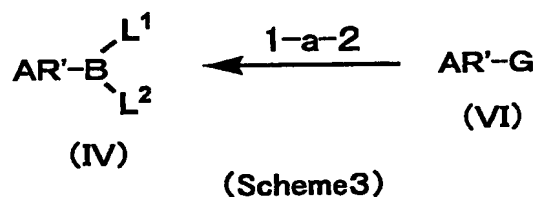
このようにして製造した化合物(Ia') の基AR'、Rs' あるいは芳香環(E') 中のV' 中に水酸基又はアミノ基の保護基が存在するならば、これらの保護基を化合物(Ia') の製造と同時、又は順次に、脱保護化することで本発明化合物(I) に変換することができる。これら水酸基及びアミノ基の保護基の選択、導入、脱保護方法については通常の化学文献、たとえばプロテクティブ・グループ・イン・オーガニック・シンセシス第三版(Protective Groups In Organic Synthesis THIRD EDITION) (John Wiley & Sons社出版) あるいは当文献記載の参考文献などを参照することができる。

【0322】

【製造法1】 (工程a-2) 化合物(IV) は、市販されている試薬を用いるか、又は次Scheme 3:

【0323】

【化8】



で表されるごとく、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる化合物(VI) を前述の文献[ケミカル・レビュー、1995年、95巻、2457頁] 又は佐藤(Y. Satoh) ら、シンセシス(SYNTHESIS)、1994年、1146頁に記載の方法あるいはこれら文献記載の参考文献に準じて製造することができる。

【0324】

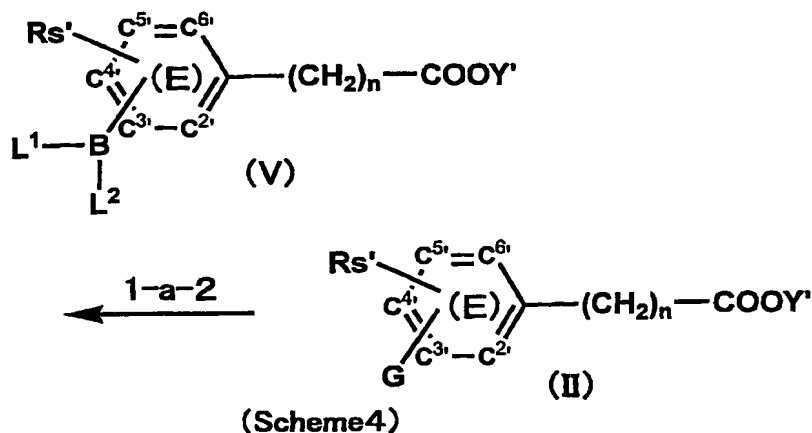
たとえば化合物(VI) をn-ブチルリチウム、t-ブチルリチウムなどのアルキルリチウムでリチオ化せしめた後、トリアルキルボレイトと反応、塩酸、硫酸、リン酸などの鉱酸で処理することで化合物(IV) を調製する方法、化合物(VI) と(アルコキシ)ジボロンをパラジウム触媒、塩基存在下、クロスカップリング反応を行うことにより化合物(VI) を調製する方法などが挙げられる。

【0325】

化合物 (V) の製造方法としては次 Scheme 4 ;

【0326】

【化9】



で表されるごとく化合物 (II) を前記工程 a-2 と同様の反応を行う方法が挙げられる。

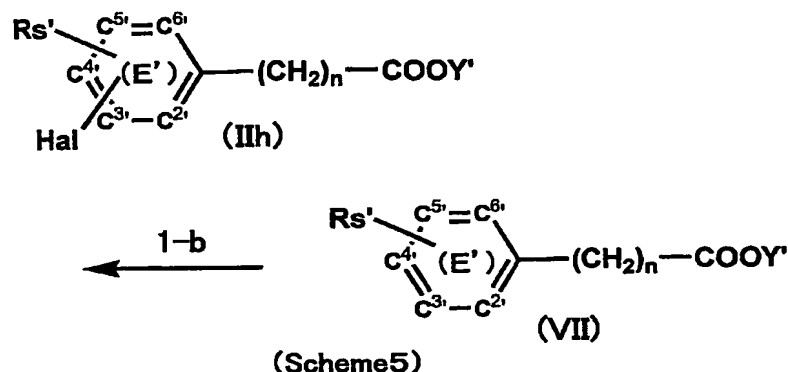
。

【0327】

【製造法1】 (工程b) 次 Scheme 5 :

【0328】

【化10】



で表されるごとく、化合物 (II) のうち G が塩素原子、臭素原子あるいはヨウ素原子などのハロゲン原子を示す一般式 (IIh) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (IIh)」と称する〕は、市販の、又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式 (VII) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (VII)」と称する〕をハロゲン化することにより製造することができる。化合物 (IIh) の式中、基 Hal は塩素原子、臭素原子あるいはヨウ素原子の何れかのハロゲン原子を示す。ハロゲン化のうち塩素化については通常の化学文献、たとえば新実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版) 14 巻、354 頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえば塩素 (Cl<sub>2</sub>) による方法、塩化スルフルルによる方法などがある。またブロム化については通常の化学文献、たとえば新実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、14 巻、354 頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえば臭素 (Br<sub>2</sub>) による方法、N-プロモスクシンイミドによる方法などがある。またヨウ素化については、通常の化学文献、たとえば新実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、14 巻、423 頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえばヨウ素 (I<sub>2</sub>) による方法、三ヨウ化カリウムによる方法などがある。

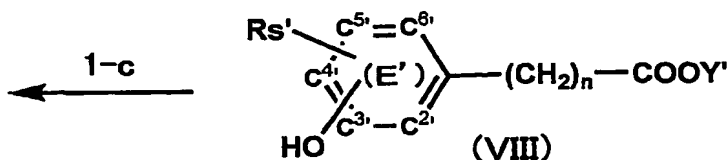
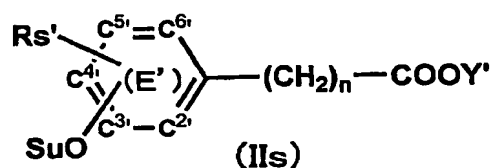
【0329】

【製造法1】 (工程c) 次 Scheme 6 :



【0330】

【化11】



(Scheme6)

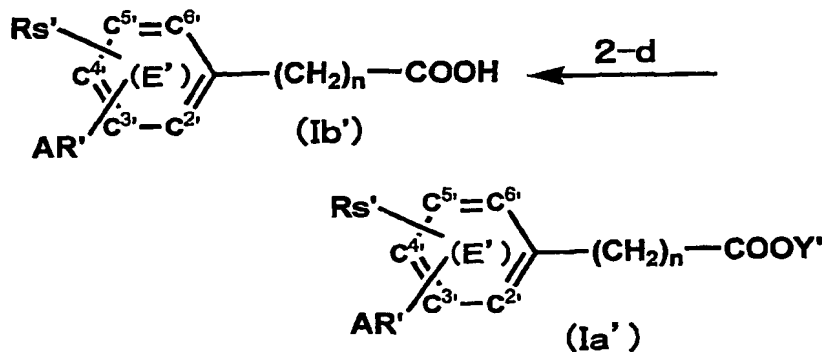
で表されるごとく、化合物 (I I) のうち G がメシラート基、トリフラート基あるいはアレーンスルホネート基などのスルホン酸エステル基を示す一般式 (I I s) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (I I s)」と称する〕は、市販の又は公知の方法あるいは公知の方法に準じて合成できる一般式 (V I I I) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (V I I I)」と称する〕をスルホン酸エステル化することにより製造することができる。化合物 (I I s) の式中、基 S u はメタンスルホニル基、トリフルオロメタンスルホニル基、又は芳香環部分が 1 個又は同一若しくは異なる 2 個以上の T<sup>1</sup> で置換されてもよいアレーンスルホニル基を示す。スルホン酸エステル化については、通常の化学文献、たとえば新実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、14 巻、1793 頁に記載の方法で製造する方法が挙げられる。たとえばスルホン酸クロリドによる方法、無水スルホン酸による方法などがある。

【0331】

【製造法 2】 (工程 d) 次 S c h e m e 7 :

【0332】

【化12】



(Scheme7)

で表されるごとく、本発明化合物 (I) の一部であって、その Y が水素原子を示し、さらに R s、A R、及び芳香環 (E) 上の V が保護されていてもよい、一般式 (I b') で表される化合物〔以下、単に「化合物 (I b')」と称する〕は、化合物 (I a') を加水分解し、基 O Y' を水酸基へと変化せしめることで製造することができる。

【0333】

化合物 (I a') から化合物 (I b') への変換反応においては、通常、塩基中で反応せしめることが好ましい。また、反応溶媒は、通常、反応を妨げない不活性媒体、好ましくは極性溶媒中で反応せしめることが好ましい。

ここで用いる塩基としては、たとえば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリ

ウム、炭酸カリウム、ナトリウムメトキシド、カリウムtertブトキシドなどのアルカリ金属塩基や、トリエチルアミンなどの有機塩基が挙げられる。これらの使用量は化合物(I a')に対し、アルカリ金属塩基の場合、通常は1~20倍モル、好ましくは1~10倍モルが例示され、また、有機塩基の場合、1倍モル~大過剰量が例示される。

#### 【0334】

また、極性溶媒としては水、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等が挙げられ、必要に応じてこれらを混合して用いることができる。反応温度は、例えば室温~溶媒の還流温度までの適当な温度が選択される。反応時間はアルカリ金属塩基を用いた場合、通常は0.5~72時間で、好ましくは1~48時間が例示され、有機塩基を用いた場合、通常は5時間~14日間の例示されるが、薄層クロマトグラフィー(TLC)、高速液体クロマトグラフィー(HPLC)等により反応経過を追跡することが可能であるから、通常は化合物(I b')の収量が最大となるところで適宜反応を終了させればよい。

#### 【0335】

このようにして得られた化合物(I b')を遊離カルボン酸の状態では反応液から採取するには、極性溶媒が水溶性溶媒である場合には、該溶媒を留去し、塩酸水などの無機酸にて中和後、残渣を非水溶性溶媒に溶解した後、弱酸性水溶液、水等で洗浄して、溶媒を留去することにより行うことが好ましい。極性溶媒が非水溶性溶媒である場合には、無機酸にて中和後、弱酸性水溶液、水等で洗浄した後、溶媒を留去することにより行うことが好ましい。

また反応後、化合物(I b')が用いた塩基との塩を形成して固体となる場合、これを常法により単離、精製することにより化合物(I b')の塩を得ることができる。

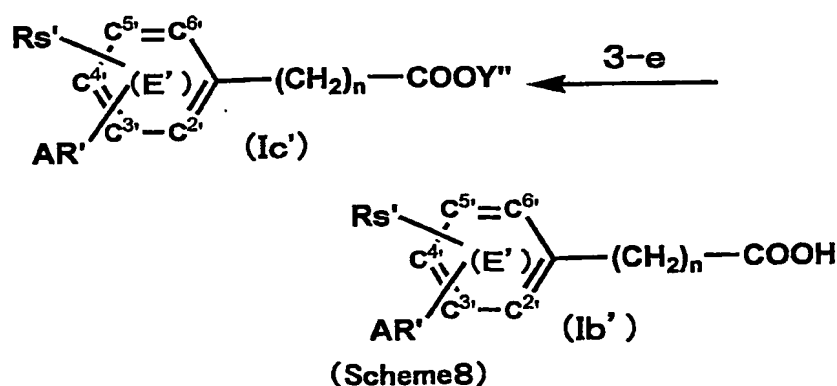
このようにして製造した化合物(I a')の基AR'、Rs'、又は芳香環(E')中のV'中に水酸基又はアミノ基の保護基が存在する場合には、これらの保護基を化合物(I a')の製造と同時、又は順次に、脱保護化することで本発明化合物(I)に変換することができる。

#### 【0336】

〔製造法3〕 (工程e) 次Scheme 8:

#### 【0337】

#### 【化13】



で表されるごとく、本発明化合物(I)の一部であって、そのYがY''を示し、さらにRs、AR及び芳香環(E)上のVが保護されていてもよい、一般式(I c')で表される化合物〔以下、単に「化合物(I c')」と称する〕は、化合物(I b')のカルボキシ基(COOH)を常法によりエステル化を行うことにより製造することができる。化合物(I b)の式中、Y''は炭素数1~4個の低級アルキル基、-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R<sup>18</sup>)(R<sup>19</sup>)又は-C(R<sup>20</sup>)<sub>2</sub>OC(O)A<sup>3</sup>R<sup>21</sup>を示す。

#### 【0338】

化合物(I c')の製造方法として、たとえば化合物(I b')を無機ハロゲン化物と

無溶媒又は不活性溶媒中反応し、酸ハロゲン化物とした後、直接、あるいは不活性な溶媒に溶解したものを過剰量の目的のY"の水酸化物と反応する方法などが挙げられる。このときの無機ハロゲン化物としては塩化チオニル、塩化ホスホリル、五塩化リン、三塩化リンなどがあり、塩化チオニルが好ましい例である。使用する量は、通常は化合物(I b')

に対して1倍モル~大過剰が例示され、好ましくは1.5~5倍モルが例示される。ここで用いられる不活性溶媒としては、たとえば、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン、クロロベンゼン等のベンゼン類が例示される。これらは単独、あるいは混合溶媒として用いることが例示される。反応を促進するため触媒量のN,N-ジメチルホルムアミドを加えてもよい。反応温度は通常は室温~溶媒の還流温度までの適当な温度が選択される。反応時間は一般的には0.5~24時間が例示され、好ましくは1~6時間が例示される。

## 【0339】

目的のY"の水酸化物との反応に用いる不活性な溶媒としては、たとえば、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等のベンゼン類が例示されるが溶媒を使用せず過剰量のY"の水酸化物と反応することも可能である。反応温度は-10℃~室温までの適当な温度が選択される。反応時間は一般的には0.5~24時間で、好ましくは0.5~6時間が例示される。

## 【0340】

化合物(I c')を製造するためのその他の方法として、たとえば、新実験化学講座(日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、1002頁に記載の「アルコールによるエステル化」、同書籍同巻、1002頁に記載の「O-アルキル化剤によるエステル化」、同書籍同巻、1008頁に記載の「ハロゲン化アルキルによるエステル化」、同書籍22巻、45頁に記載の「脱水剤を用いるエステル化反応」などが挙げられる。

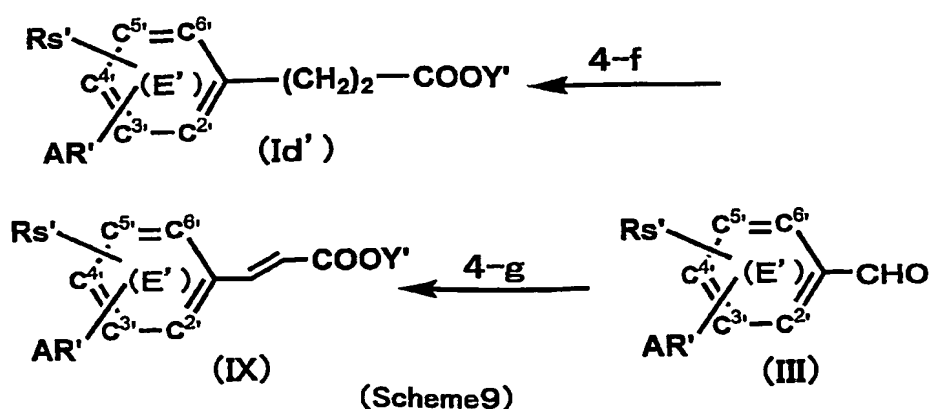
基AR'、Rs'、又は芳香環(E')中のV'中に上記反応条件において反応性のある水酸基又はアミノ基が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。このようにして製造した化合物(I c')の基AR'、Rs'あるいは芳香環(E')中のV'中に水酸基又はアミノ基の保護基が存在するならば、これらの保護基を化合物(I c')の製造と同時、又は順次に、脱保護化することで本発明化合物(I)に変換することができる。

## 【0341】

【製造法4】次Scheme9:

## 【0342】

## 【化14】



で表されるごとく、本発明化合物(I)の一部であって、そのメチレン部分のnが整数2を示し、さらにRs、AR及び芳香環(E)上のVが保護されていてもよい、一般式(I

d') で表される本発明化合物〔以下、単に「化合物 (I d')」と称する〕は、例えば以下に示す方法でも製造することができる。

【0343】

〔製造法4〕 (工程 f) すなわち化合物 (I d') は一般式 (I X) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (I X)」と称する〕の二重結合を通常の化学文献記載の還元反応を用いて製造することができる。たとえば、メタノールなどアルコール系溶媒や酢酸エチルなどエステル系溶媒の単独又は混合溶媒中、パラジウム炭素粉末、酸化白金 ( $\text{PtO}_2$ )、活性化ニッケルなどの触媒存在下、水素ガス、ギ酸アンモニウム、ヒドラジン水和物などの水素源を用いて水素添加し、化合物 (I X) の二重結合を単結合に変化する方法などがある。

基  $\text{AR}'$ 、 $\text{Rs}'$ 、又は芳香環 ( $\text{E}'$ ) 中の  $\text{V}'$  中に上記反応条件において反応性のある、あるいは反応の妨げとなる水酸基又はアミノ基が存在する場合、この置換基は保護されていることが好ましい。

また、このようにして製造した化合物 (I d') の基  $\text{AR}'$ 、 $\text{Rs}'$ 、又は芳香環 ( $\text{E}'$ ) 中の  $\text{V}'$  中に水酸基又はアミノ基の保護基が存在するならば、これらの保護基を化合物 (I d') の製造と同時、又は順次に、脱保護化することで本発明化合物 (I) に変換することができる。

【0344】

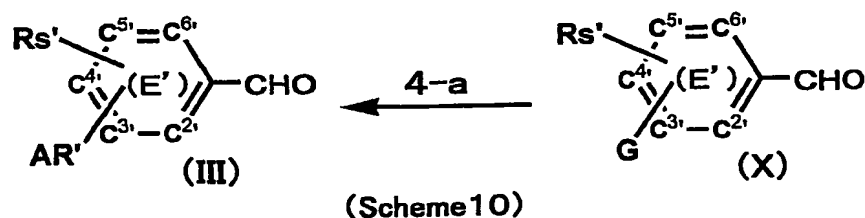
〔製造法4〕 (工程 g) 化合物 (I X) は一般式 (I I I) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (I I I)」と称する〕から製造することができる。たとえば、新実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、14巻、238頁に記載のホーナー・エモンズ反応により製造する方法が挙げられる。すなわち、化合物 (I I I) をメタノール、エタノールなどのアルコール系溶媒やテトラヒドロフラン、ジメトキシエタンなどのエーテル系溶媒などの不活性溶媒中、水素化ナトリウム、ナトリウムアルコキシドなどの塩基の存在下、市販のジアルキルホスホ酢酸エステルと反応することにより得ることができる。反応温度は一般的に  $-10^\circ\text{C}$  ~ 溶媒の還流温度までの適当な温度が選択されるが、好ましくは  $0^\circ\text{C}$  ~ 室温が例示される。反応時間は一般的には1時間 ~ 16時間で、好ましくは2 ~ 8時間であるが、薄層クロマトグラフィー (TLC)、高速液体クロマトグラフィー (HPLC) 等により反応経過を追跡することが可能であるから、通常は化合物 (I X) の収量が最大となるところで適宜反応を終了させればよい。

【0345】

〔製造法4〕 (工程 a) 次 Scheme 10:

【0346】

【化15】



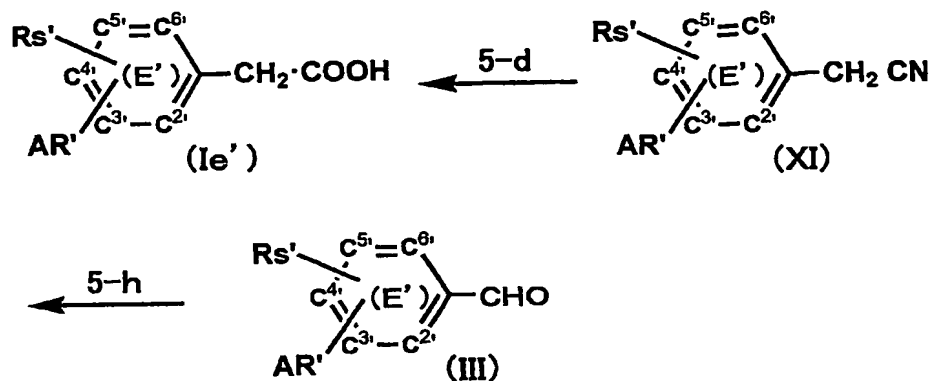
で表されるごとく、化合物 (I I I) は市販のあるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な一般式 (X) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (X)」と称する〕に前述の製造法1の工程 a-1 で示したいずれかの方法で置換基  $\text{AR}'$  を導入することにより製造することができる。

【0347】

〔製造法5〕 次 Scheme 11:

【0348】

## 【化16】



(Scheme 11)

で表されるごとく、本発明化合物 (I) の一部であって、そのメチレン部分の  $n$  が整数 1 を示し、 $Y$  が水素原子を示し、さらに  $Rs$ 、 $AR$ 、及び芳香環 (E) 上の  $V$  が保護されていてもよい、一般式 (Ie') で表される本発明化合物〔以下、単に「化合物 (Ie')」と称する〕は、例えば以下に示す方法でも製造することができる。

## 【0349】

〔製造法 7〕 (工程 d) すなわち化合物 (Ie') は一般式 (XI) で表される化合物〔以下、単に「化合物 (XI)」と称する〕のニトリル基を前述の製造法 2 の工程 d で示した方法に準じてカルボキシル基に加水分解することにより製造することができる。このようにして製造した化合物 (Ie') の基  $AR'$ 、 $Rs'$ 、又は芳香環 (E') 中の  $V'$  中に水酸基又はアミノ基の保護基が存在する場合には、これらの保護基を化合物 (Ie') の製造と同時、又は順次に、脱保護化することで本発明化合物 (I) に変換することができる。

## 【0350】

〔製造法 5〕 (工程 h) 化合物 (XI) は前述の化合物 (III) より製造することができる。例えば、化合物 (III) を第 4 版実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、20 巻、445 頁に記載のトリメチルシリルシアニドとルイス酸、とくにヨウ化亜鉛を触媒としてテトラヒドロフランなどの不活性溶媒中反応せしめる。その後、第 4 版実験化学講座 (日本化学会編、丸善株式会社出版)、26 巻、197 頁に記載のヒドロシランによる還元反応を行う。還元反応の例としては、ジクロロメタンなどのハロゲン化溶媒中、トリエチルシランなどのヒドロシランとトリフルオロ酢酸などのプロトン酸、あるいはトリフッ化ホウ素などのルイス酸とで還元せしめる方法などがある。

## 【0351】

本発明化合物 (I) の製造方法はここに記載された方法に限定されるものではない。例えば本発明化合物は、その前駆体となる化合物の置換基を通常の化学文献等に記載の反応を一つ又は複数を組み合わせ、修飾・変換することにより製造することができる。本発明化合物 (I) のうち  $Rs$  に不斉炭素を含むものの製造法の例としては、 $Rs$  の不斉炭素にあたる部分があらかじめ光学活性である市販の (あるいは公知の方法又は公知の方法に準じて調製可能な) 原料化合物を用いる方法が挙げられる。また本発明化合物又はその前駆体を常法により光学的に活性な異性体として分離する方法もある。その方法としては、たとえば光学活性カラムを用いた高速液体クロマトグラフィー (HPLC) によるもの、光学活性な試薬と縮合し生成するジアステレオマーを分離精製した後、再び分解する方法などがある。前駆体を分離し光学活性体とした場合、その後に先に示した製造法を実施することにより光学的に活性な本発明化合物 (I) を製造することができる。

## 【0352】

本発明化合物 (I) のうち、化合物中にカルボキシル基、フェノール性水酸基などの酸性官能基を含む場合、公知の手段によって薬学上許容される塩 (たとえばナトリウム、ア

ンモニア等との無機塩又はトリエチルアミン等との有機塩) とすることも可能である。たとえば、無機塩を得る場合、本発明化合物 (I) を所望の無機塩に対応する少なくとも 1 当量の水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩などを含有する水中に溶かすことが好ましい。該反応には、メタノール、エタノール、アセトン、ジオキサンなどの水混和性の不活性有機溶媒を混和してもよい。たとえば、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウム又は重炭酸ナトリウムを用いることによりナトリウム塩の溶液が得られる。

#### 【0353】

また本発明化合物 (I) のうち、化合物中にアミノ基など塩基性官能基を含む場合、又はそれ自体塩基性の性質を持つ芳香環 (例えばピリジン環など) を含む場合、公知の手段によって薬学上許容される塩 (たとえば塩酸、硫酸等の無機酸との塩又は酢酸、クエン酸等の有機酸との塩) とすることも可能である。たとえば、無機塩を得る場合、本発明化合物 (I) を所望の少なくとも 1 当量の無機酸を含有する水溶液に溶かすことが好ましい。該反応には、メタノール、エタノール、アセトン、ジオキサンなどの水混和性の不活性有機溶媒を混和してもよい。たとえば、塩酸を用いることにより塩酸塩の溶液が得られる。

#### 【0354】

固形塩が所望の場合、該溶液を蒸発させるか、又はさらにブタノール、エチルメチルケトンなどのようなある程度極性のある水混和性有機溶媒を加え、その固形塩を得ればよい。

本発明に記載の種々の化合物は、公知の方法、たとえば、再結晶化、各種クロマトグラフィー (カラム、フラッシュカラム、薄層、高速液体) により精製を行うことができる。

#### 【0355】

本発明化合物 (I) 及び薬理学的に許容されるその塩は、プロスタグランジン及びロイコトリエンの両者の産生に対して抑制作用を有する。プロスタグランジン及び/又はロイコトリエンの産生に対する抑制作用としては、例えば化合物の濃度が細胞障害の認められない濃度で、培養ヒト骨肉腫細胞株である MG-63 細胞を IL-1 $\beta$  で刺激したときの PGE<sub>2</sub> 産生を、及び/又は培養ラットマストサイトーマ株である RBL-2H3 細胞を IgE で刺激したときの PGD<sub>2</sub> 及び LTB<sub>4</sub> 産生を、陽性コントロールに対して 10% 以上、好ましくは 30% 以上、特に好ましくは 50% 以上抑制する作用が例示される。その分子作用的機序としてはプロスタグランジンを産生する COX-1 及び/又は COX-2 ならびにロイコトリエンを産生する 5-L<sub>O</sub> の両者を阻害することが考えられる。あるいはプロスタグランジン及びロイコトリエンの産生にかかわる 2A 型、4 型あるいは 5 型の PLA<sub>2</sub> の酵素活性を本発明化合物が阻害してアラキドン酸の産生を抑制することが考えられる。

#### 【0356】

これらの分子作用的機序の中で、本発明化合物 (I) は 4 型 PLA<sub>2</sub> の酵素活性を阻害すると考えられる。例えば、その判断に際しては、4 型 PLA<sub>2</sub> の酵素活性に対する阻害作用を調べればよく、公知の 4 型 PLA<sub>2</sub> の酵素活性測定方法を利用することも好ましい。

[Clark ら、プロシーディング・オブ・ナショナル・アカデミー・オブ・サイエンス・USA (Proc. Natl. Acad. Sci. USA)、1990 年、87 巻、7708 頁]、[Gronich ら、バイオケミカル・ジャーナル (Biochem. J.)、1990 年、271 巻、37 頁]、[Clark ら、セル (Cell)、1991 年、65 巻、1043 頁]、[Kramer ら、ジャーナル・オブ・バイオリジカル・ケミストリー (J. Biol. Chem.)、1991 年、266 巻、5268 頁]。これらの方法を用いて本発明化合物の 4 型 PLA<sub>2</sub> 阻害活性を明らかにすることができる。

#### 【0357】

本発明化合物 (I) 及び薬理学的に許容されるその塩は、マウスの炎症性浮腫、アレルギー性浮腫、酢酸ライジング反応及びラットアジュバント関節炎を 0.1~500 mg/kg の経口投与で抑制すること、一方マウスに 500 mg/kg/日を 3 日間経口投与しても死亡例が認められなかったことから、哺乳動物、好ましくは人、イヌやネコなどのペット又はコンパニオンアニマルあるいは家畜における医薬として安全な化合物であり、医

薬品の活性成分として有用な物質である。哺乳動物、好ましくは人、イヌやネコなどのペット又はコンパニオンアニマルあるいは家畜における医薬としてはプロスタグランジン及び／又はロイコトリエンの産生を起因とする各種の急性又は慢性の炎症反応が認められる状態、各種疾患あるいは病態、すなわち炎症性疾患、アレルギー性疾患、自己免疫疾患、疼痛に対する予防及び／又は治療薬のいずれかが好ましい例として挙げられる。

#### 【0358】

さらに具体的な症状又は疾患として関節炎、慢性関節リウマチ、悪性関節リウマチ、若年性関節リウマチ、フェルティ症候群、成人スティル病、変形性関節炎、滑膜炎、痛風、人工関節インプラントのゆるみ、発熱、一般的な感冒、痛覚過敏、火傷、熱傷、ケロイド形成、月経痛、月経困難、月経痙攣、アレルギー反応、アレルギー性接触過敏症、アレルギー性鼻炎、花粉症、アレルギー性結膜炎、過敏性肺臓炎、アレルギー性気管支肺真菌症、気腫、急性呼吸促迫症候群、喘息、気管支炎、慢性閉塞性肺疾患、慢性気管支炎、肺炎、びまん性汎細気管支炎、気道閉塞症、移植片対宿主症候群、蕁麻疹、紫外線皮膚炎、アトピー性皮膚炎、癌、骨髄性白血病、肉腫、脳腫瘍、悪液質、組織潰瘍、消化性潰瘍、胃炎、急性及び慢性脾炎、限局性腸炎、潰瘍性大腸炎、憩室炎、再発性胃腸病変、胃腸出血、炎症性腸疾患、クローン病、腸管型パーチェット病、感染性腸炎、虚血性腸炎、放射線腸炎、薬剤性腸炎、過敏性腸症候、急性肝炎、劇症性肝炎、慢性肝炎、肝硬変、脂肪肝、アルコール性肝障害、薬剤性肝障害（薬物中毒肝炎）、うっ血性肝炎、自己免疫性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、肝性ポルフィリン症等の肝疾患（肝障害、肝不全）、凝固、貧血、強直性脊椎炎、再狭窄、歯周病、表皮水泡症、アテローム性硬化症、大動脈瘤、結節性動脈周囲炎、うっ血性心不全、不整脈、心筋梗塞、脳梗塞、発作、大脳虚血、頭部外傷、脊髄損傷、脊髄性筋萎縮症、神経痛、神経変性疾患、アルツハイマー病、ルーウィボアイ病、シャイドレイガー症候群、ライ症候群、進行性核上性麻痺、進行性多巣性白質脳症、正常圧水頭症、亜急性硬化性全脳炎、前頭葉型痴呆、急性灰白髄炎（ポリオ）、ポリオ神経症、ウイルス性脳炎、クロイツフェルトーヤコブ病、クールー病、牛海綿状脳症（狂牛病）、スクレイピー、てんかん、大脳アミロイド血管障害、自己免疫疾患、ハンテイングトン病、パーキンソン病、片頭痛、うつ病、躁病、躁うつ病、遺伝性小脳性運動失調、末梢神経障害、緑内障、疼痛、歯肉炎、手術後の痛み、筋萎縮性側索硬化症、骨粗鬆症、多発性硬化症、目の脈管形成、角膜損傷、黄斑変性、結膜炎、異常創傷治癒、筋肉もしくは関節の捻挫又は緊張、腱炎、皮膚疾患、尋常性乾癬、膿疱性乾癬、乾癬性紅皮症、関節症性乾癬、重症筋無力症、多発性筋炎、筋炎、滑液包炎、糖尿病、腫瘍浸潤、腫瘍成長、腫瘍転移、角膜傷跡、強膜炎、免疫不全疾患、強皮症、好酸球性筋膜炎、敗血症、エンドトキシنشOCK、早産、低プロトロンビン血症、血友病、甲状腺炎、サルコイドーシス、パーチェット症候群、過敏症、腎臓疾患、リケッチア感染症、原虫症、生殖疾患又は敗血症ショックなどが挙げられる。またその他の具体的な症状又は疾患として歯痛、抜歯後の痛み、背腰痛、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、腱鞘炎、急性上気道炎、带状疱疹、線維症、肺線維症、塵肺症、慢性間質性肺炎、肉芽腫性間質性肺炎、線維化性間質性肺炎、腎線維症、腎盂腎炎、各種続発性萎縮腎、糸球体腎炎、慢性腎炎、糸球体硬化、肝線維症、心筋梗塞後の心線維症、特発性心筋症、脾硬化症、脾線維症、脾石症、高安動脈炎、慢性甲状腺炎、皮膚筋炎、多発性筋炎、骨髄線維症、Banti病、後腹膜線維症、各種放射線傷害なども挙げられる。また本発明化合物（I）を有効成分とする医薬は哺乳動物、好ましくは人、イヌやネコなどのペット又はコンパニオンアニマルあるいは家畜における上記症状又は疾患に対して他の一種類以上の予防又は治療薬と併用又は組み合わせて使用することができる。

#### 【0359】

併用または組み合わせることができる薬剤としては、たとえば以下のようなものが例示できる。慢性関節リウマチの治療薬として使われる免疫修飾型抗リウマチ薬や代謝拮抗薬、具体的には金製剤、プシラミン、ロベンザリット、サラゾスルファピリジン、メトトレキセート、アザチオプリン、ミゾリピン、レフルノミド、タクロリムス、シクロスポリン等やそれらを含む製剤；生物学的製剤であるインターロイキン（IL）-1、IL-6ま

たは腫瘍壊死因子 (TNF) -  $\alpha$  などのサイトカインに対する抗サイトカイン抗体製剤、若しくはそれらサイトカインに対する可溶性受容体製剤、具体的にはインフリキシマブやエタネルセプト等やそれらを含む製剤；ステロイド製剤、具体的にはデキサメタゾン、ベタメタゾン、プレドニゾロン、フルチカゾンやベクロメタゾン等やそれらを含む製剤；慢性気管支喘息の治療薬として使われる気管支拡張薬、具体的にはアドレナリン  $\beta$  2 刺激薬であるサルメテロールやサルブタモール、抗コリン薬であるイプラトロピウム等やそれらを含む製剤；アレルギー性疾患の治療薬、例えばキサンチン類縁薬であるテオフィリン等、抗アレルギー薬であるフェキソキナジン、エピナスタチン、セチリジン、ケトチフェン、クロモグリク酸ナトリウム、ペミロラスト等、あるいは抗ヒスタミン薬であるフェキソキナジンやセチリジン等やそれらを含む製剤；抗腫瘍薬であるイリノテカン、5-フルオロウラシル等やそれらを含む製剤。また放射線療法と併用または組み合わせて本発明化合物 (I) を有効成分とする医薬を使用することも例示される。

#### 【0360】

本発明化合物 (I) 又は薬学上許容される塩を上記の医薬として用いるには、有効量の本発明化合物 (I) 又は薬学上許容される塩をそのまま用いてもよく、あるいは薬学上許容される担体と混合して医薬組成物として用いてもよい。この担体として、たとえばカルボキシメチルセルロースなどの懸濁化剤や場合によっては、精製水、生理食塩水などであってもよく、その他の公知の担体も用いることができる。一例を示すと本発明化合物 (I) 又は薬学上許容される塩を 0.5% カルボキシメチルセルロースを含む精製水に懸濁又は溶解し用いる方法が挙げられる。

#### 【0361】

上記医薬組成物の製剤化のための剤形としては、錠剤、散剤、顆粒剤、シロップ剤、懸濁剤、カプセル剤、注射剤が挙げられるが、その製造のためには、これらの製剤に応じた各種担体を使用される。たとえば、経口剤の担体としては、賦形剤、結合剤、滑沢剤、流動性促進剤、着色剤を挙げることができる。

本発明化合物を注射剤等の非経口剤とする場合には、希釈剤として一般に注射用蒸留水、生理食塩水、ブドウ糖水溶液、注射用植物油、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール等を使用することができる。さらに必要に応じて、殺菌剤、防腐剤、安定剤、等張化剤、無痛化剤等を加えてもよい。

本発明の医薬を哺乳類、たとえば人に投与する際には、錠剤、散剤、顆粒剤、懸濁剤、カプセル剤の形で経口投与することができ、また、点滴を含む注射剤、さらには吸入剤、坐剤、ゲル剤、ローション剤、軟膏剤、クリーム又はスプレーの形で非経口投与することができる。その投与量は、適用症、投与形態、患者の年齢、体重、症状の度合いなどによって異なるが、一般的には成人 1 日当たり 1~1000 mg を 1~3 回に分けて投与することが例示される。投与期間は数日~2 カ月の連日投与が一般的であるが、患者の症状により 1 日投与量、投与期間共に増減することができる。

#### 【0362】

組織の線維化を特徴とする疾患である線維症は、しばしば生命に関係する重篤な疾患として知られている。組織の線維化は、線維芽細胞を代表とする間質細胞の増殖とコラーゲンなどの細胞外基質の産生によって起こる。線維化は臓器における組織障害に対する修復機構と考えられる。過剰な線維化は臓器の線維化疾患を起こし、さらに線維化が進行することによって硬化性疾患を起こす。このような硬化性疾患は難治性、進行性かつ不可逆的なものが多い。各種臓器の線維化は多様であるが、線維化の病因仮説は共通している部分が多い。すなわち、ある種の炎症性病変が先行し、その修復過程において主として免疫担当細胞や血小板から、また修復に関与する線維芽細胞等の間質細胞自身によって、種々のサイトカイン、増殖因子が産生、活性化され、それらが細胞外基質の沈着を起こす、と考えられている。[竹原、モレキュラー・メディシン (Molecular Medicine)、2001年、38巻、854頁]。

#### 【0363】

線維症の中で肺線維症は代表的な疾患の一つである。肺線維症は肺胞壁における慢性的



な炎症と膠原線維の増加により肺胞構造の破壊を来し、終局的には呼吸不全そして死に至る疾患である。例えば、肺線維症は感染性の肺炎などに引き続いて発症する。感染性の肺炎としては重症急性呼吸器症候群（SARS）やインフルエンザ肺炎などが挙げられる。特にSARSでは肺の間質で高度の炎症が起こり、その結果肺線維症となる比率が高いことが報告されている〔Antoninoら、ラジオロジー（Radiology）、2003年〕。また、肺線維症は各種の薬剤によっても引き起こされる。

#### 【0364】

近年、種々の疾患の診断、治療、予防等のために用いられる薬剤の増加に伴って、これらの薬剤によって引き起こされる薬剤誘起性肺線維症が増加してきている。薬剤誘起性肺線維症は終局的には死に至る重篤な疾患であり、また種々の疾患治療上の大きな問題となることから、特に、薬剤誘起性肺線維症の予防あるいは治療は重要な関心事である。薬剤誘起性肺線維症に対しては、現在、ステロイド療法が用いられている。しかしながら、ステロイド療法による奏効率は低く、効果も部分的かつ一過性であり、病変が残存することが多い〔医学のあゆみ、2001年、197巻、313頁〕。また、ステロイド剤の副作用や減量・中止による急性増悪もしばしば見られ、臨床において決して満足できるレベルではない。

#### 【0365】

最近の知見では、ピルフェニドンが肺線維症に対して投与効果があることが米国〔Raghuら、アメリカン・ジャーナル・オブ・レスピラトリ・アンド・クリティカル・ケア・メディシン（American journal of respiratory and critical care medicine）、1999年、159巻、1061頁〕及び日本〔Nagaiら、インターナル・メディシン（Internal Medicine）、2002年、41巻、1118頁〕での臨床試験において報告されているが、いずれにしても、これらの疾患に対して有効性の高い、新たな予防及び／又は治療薬の開発が望まれている。

#### 【0366】

本発明により提供される医薬は、4型PLA<sub>2</sub>阻害剤を有効成分とする線維症、好ましくは肺線維症、さらに好ましくは薬剤誘起性の肺線維症の予防及び／又は治療のための医薬として有用である。

前述の通り、線維症、とりわけ肺線維症は重篤な疾患であり重要な予防及び／又は治療対象である。肺線維症に関しては、初期の肺胞障害を生じる原因として、有毒ガスや各種薬剤等、100種類以上の因子が明らかにされている。種々の疾患の診断、治療、予防等のために用いられる薬剤の増加に伴って、これらの薬剤によって引き起こされる薬剤誘起性肺線維症が増加してきていることは、前述の通りである。

#### 【0367】

薬剤誘起性肺線維症は、咳嗽、呼吸困難、発熱等の症状発現と薬剤投与の因果関係が疑われ、また、胸部X線写真上びまん性に間質性陰影が同時あるいは少し遅れて出現してくると言われている。

薬剤誘起性肺線維症を引き起こすと言われている薬剤としては、抗がん剤、抗リウマチ剤、免疫抑制剤、抗生物質、化学療法剤、降圧剤、利尿剤、消炎・鎮痛剤、生物製剤または漢方薬剤などで知られている〔猪岡ら、治療学、1995年、29巻、1295頁〕。代表的な薬剤を表1に示す。

#### 【0368】

【表1】

分類	薬物例
1) 抗癌 免疫抑制剤	ペブロマイシン、ブレオマイシン、シクロフォスファミド、ニトロソウレア、ブスルファン、メトトレキセート、アザチオプリン、マイトマイシン-C、テガフル、カルモフル、テガフル・ウラシル配合剤、シスプラチン、ドキシソルピシン、6-メルカプトプリン、ダウノマイシン、ピンクリスチン、ピンブラスチン、ビンデシン、プロカルバジン、ネオカルチノスタチン、メルファラン、チオテパ、ニムスチン、シタラビン、ジノスタチンステイマラマー、クロラムブシル、カルムスチン、ロムスチン、セムスチン、テニボシド、エトボシド、タキソール、タキソテール、イリノテカン、ゲフィチニブ、タモキシフェンなど
2) 降圧 利尿剤	$\alpha$ -メチルドパ、トリクロルメチアザイド、ハイドロクロロチアジド、エナラプリル、ヘキサメトニウム、メカミラミン、ペントリニウム、プラクトロール、ピンドロール、プロプラノロール、アセプトロール、ヒドララジンなど
3) 抗生物質 化学療法剤	セフェム系抗生物質（セファロリジン、セファロチン、セファレキシム、セフラジン、セファゾリン、セファクロル、セフメノキシム、セフメタゾール、セフォペラゾン、セフォチアム、セフロキサジン、セフチゾキシム、ラタモキシセフなど）、テトラサイクリン（ミノサイクリン、オキシサイクリン）、抗結核薬（イソニアジド、パラアミノサリチル酸、リファンピシン、ストレプトマイシン）、ペニシリン系抗生剤（アンピシリン、ピペラシリン、ばすとしりん、ペントシリン、アモキシシリン）、アミノグリコシド系抗生物質（ストレプトマイシン）、マクロライド系抗生物質（ミデカマイシン）、フォスフォマイシン、アミノ配糖体（トブラマイシン、ミクロマイシン）、新キノロン薬（エノキサミン、オフロキサシン、ノルフロキサシン）、抗真菌薬（アムホテリシン）など
4) その他	吸入剤（クロモグリク酸など）、金製剤（金チオオリゴ酸など）、向精神・神経薬（アミノトリプチリン、ジフェニルヒダントイン、カルバマゼピン、フェノバルビタール、バルプロエート塩、イミプラミン、メフェネシン、メプロパメート）、消炎・鎮痛薬（ナプロキセン、アセトアミノフェン、アセチルサリチル酸、フェナセチン、ジクロフェナック、ロキソプロフェン、フェンブフェン、ナブトメン、アルミノプロフェンなど）、抗不整脈剤（アミオダロン、プロカインアミド、アブリンジン）、糖尿病治療薬（クロロプロパミド）、抗甲状腺剤（チオウラシル）、蛋白分解酵素（セラペプチダーゼ）、抗パーキンソン薬（レボドパ、プロモクリプチン）、リウマチ治療剤（ブシラミン、オーラノフィン、アクタリット）、小柴胡湯、柴苓湯、六君子湯、インターフェロン、ワーファリン、サラゾスルファピリジン、ジクロルフェラミド、ホミノベン、D-ペニシラミン、プロピルチオウラシル、コルチコステロイド、フラボキサート、アロプリノール、エトキシスクレロール、など

例えば、慢性関節リウマチの治療では、疾患修飾型抗リウマチ薬として、メトトレキセート、金チオオリゴ酸ナトリウムなどの肺線維症を高い頻度で引き起こす薬物が使われている。また、頻度は比較的高くはないが肺線維症を引き起こす恐れのあるアクタリット、ブシラミン、オーラノフィン、サラゾスルファピリジン、D-ペニシラミンなどの疾患修飾型抗リウマチ薬も使われている。これらの疾患修飾型抗リウマチ薬は関節リウマチ治療体系上有用な薬物であるが、副作用としておこる肺線維症がこれらの薬剤の使用を制限する要因となっている。特に近年、メトトレキセートが抗リウマチ薬として使われるようになり、メトトレキセートの副作用による、病理組織学的には間質性肺炎とも呼ばれる肺線

維症の発症が関節リウマチ治療体系上の問題になってきている。

【0369】

また、癌の治療においては、シクロフォスファミド、タキソール、エトポシド、シスプラチン、ビンクリスチン、ビンブラスチン、イリノテカン、ゲフィチニブ又はプレオマイシンが抗癌剤として有用である。しかし、これらの抗癌剤はいずれも副作用として、病理組織学的には間質性肺炎とも呼ばれる肺線維症を高い頻度で引き起こすことから、治療体系上の問題になっている。プレオマイシン、ゲフィチニブ、イリノテカン、シスプラチンは肺癌の治療に使われるが、肺癌患者が肺線維症を併発した場合、患者にとって致命的となる可能性が非常に高くなる。これらの薬剤の中でもプレオマイシンは高頻度に肺線維症を引き起こすことが問題になっている。

本発明の医薬の好ましい適用対象は、上述の各薬剤により引き起こされる薬剤誘起性肺線維症である。

【0370】

本発明において、4型PLA<sub>2</sub>阻害剤としては、4型PLA<sub>2</sub>阻害活性を有する化合物であれば特に限定されないが、例えば、公知の4型PLA<sub>2</sub>阻害剤を選択することができる。すなわち、公知の4型PLA<sub>2</sub>阻害剤として、例えば、以下の阻害剤があげられる。米国特許第5462954号明細に記載の化合物、好ましくは2-フェニル-4-エチル-5-[6-(2H-テトラゾール-5-イル)-6-メチルヘプチルオキシ]フェノール、8-プロピル-7-{3-[4-(4-フルオロフェニル)-2-エチル-5-ヒドロキシフェニルオキシ]プロピルオキシ}-3, 4-ジヒドロ-2H-1-ベンゾピラン-2-カルボン酸及び2-{3-[3-([5-エチル-2-ヒドロキシ(1, 1'-ビフェニル)-4-イル]オキシ)プロピルオキシ]-2-プロピルフェニルオキシ}プロピオン酸などが例示される。WO99/43654に記載の化合物、好ましくは4-(1-ベンズヒドリル-6-クロロ-1H-インドール-3-イルメチル)-3-メトキシ安息香酸などが例示される。WO98/33797に記載の化合物が挙げられ、好ましくはN-{4-(ビフェニル-2-イルメチル-イソブチルアミノ)-1-[2-(4-フルオロベンゾイル)ベンゾイル]ピロリジン-2-イルメチル}-3-[4-(2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)フェニル]アクリルアミドなどが例示される。WO01/30387に記載の化合物、好ましくはN-{1-[2-(2, 4-ジフルオロベンゾイル)ベンゾイル]-4-トリチルスルファニルピロリジン-2-イルメチル}-4-(2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル)安息香酸アミドなどが例示される。WO99/15129に記載の化合物、好ましくは4-{4-[2-(2-[ビス(4-クロロフェニル)メトキシ]エチルスルホニル)エトキシ]フェニル}-1, 1, 1-トリフルオロ-2-ブタノンなどが例示される。WO98/05637に記載の化合物、好ましくは1-{2-[4-(カルボキシメチル)フェノキシ]エチル}-3-ドデカノイルインドール-2-カルボン酸などが例示される。特開2002-80368に記載の化合物、好ましくは4-メチル-2-オキソ-5-(5, 6, 7, 8-テトラヒドロナフタレン-2-イル)オキサゾリジン-3-カルボン酸(6-メトキシテトラヒドロピラン-2-イル)アミド及び4-メチル-2-オキソ-5-(4-メチルフェニル)チアゾリジン-3-カルボン酸(テトラヒドロピラン-2-イル)アミドなどが例示される。また、WO98/08818に記載の化合物、WO99/43651に記載の化合物、WO99/43672に記載の化合物、WO03/048122に記載の化合物、WO95/10508に記載の化合物、WO97/05135に記載の化合物、特開平7-126166号公報に記載の化合物、特開平7-224076に記載の化合物、特開平7-224076号公報に記載の化合物、特開2000-119292号公報に記載の化合物、特開2000-109432号公報に記載の化合物、特開平7-223997号公報に記載の化合物、米国特許第5994398号明細に記載の化合物、WO00/27824に記載の化合物、特開2000-38380号公報に記載の化合物、WO00/71118に記載の化合物、日本国特許第3107613号に記載の化合物、WO03/031414に記載の化合物、米国特許第5453443号明細に記載の化合物、WO02/038

575に記載の化合物から選択される4型PLA<sub>2</sub>阻害剤が挙げられる。さらにまた、下記文献に記載の公知4型PLA<sub>2</sub>阻害剤が挙げられる。アラキドニルトリフルオロメチルケトン [Streetら、バイオケミストリー (Biochemistry)、1993年、32巻、5935頁] ; メチルアラキドニルフオスフェート [Kennedyら、メディエーターズ・オブ・インフラメーション (Mediators of Inflammation)、1994年、3巻、337頁] ;  $\beta$ -ラクタム誘導体 [Burkeら、ジャーナル・オブ・エンザイム・インヒビション (J. Enzyme Inhibition)、1998年、13巻195頁] ; コリン誘導体 [Burkeら、ジャーナル・オブ・バイオロジカル・ケミストリー (J. Biol. Chem.)、1999年、274巻、18864頁] ; 1, 3-ジ置換プロパン-2-オン誘導体、特に4- [3- (4-デシルオキシフェニルオキシ) -2-オキソプロピルオキシ] 安息香酸 [Connollyら、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー (J. Med. Chem.)、2002年、45巻、1348頁] ; Surfactin [Kimら、バイオケミカル・ファーマコロジー (Biochem. Pharmacol.)、1998年、55巻、975頁] ; 1, 1, 1-トリフルオロノナデカ-10, 13, 16-トリエン-2-オン及び1, 1, 1-トリフルオロノナデカ-10, 13-ジエン-2-オン [Amandi-Burgermeisterら、ヨーロッパ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー (Eur. J. Pharmacol.)、1997年、326巻、237頁] ; 2-オキソアミド誘導体 [Kokotosら、ジャーナル・オブ・メディシナル・ケミストリー (J. Med. Chem.)、2002年、45巻、2891頁]。

#### 【0371】

さらにまた、本発明において4型PLA<sub>2</sub>阻害剤としては、前記一般式(I)で表される化合物又はその薬理学上許容される塩が好ましい例として挙げられる。本願明細書に記載された一般式(I)で表される化合物又はその薬理学上許容される塩に関連する各種の組み合わせも任意に選択することができる。

#### 【0372】

4型PLA<sub>2</sub>阻害剤を有効成分として含む線維症の予防及び/又は治療剤として用いるには、例えば本発明化合物(I)については有効量の本発明化合物(I)又は薬学上許容される塩をそのまま用いてもよく、あるいは薬学上許容される担体と混合して固体、液体もしくはゲル状等の医薬組成物となるように調製して用いることができる。この薬学上許容される担体としては公知情報や本願明細書に記載された担体についての情報が参考となる。公知の4型PLA<sub>2</sub>阻害剤については有効量の公知4型PLA<sub>2</sub>阻害剤又は薬学上許容される塩をそのまま用いるか、あるいは薬学上許容される担体と混合して同様に医薬組成物となるように調製すればよい。

なお、本発明における予防及び/又は治療のための医薬の範囲には、場合により病状の進行を防止するための進行防止剤が包含されることは当業者に容易に理解できる。

#### 【0373】

上記医薬組成物の製剤化のための剤形としては、錠剤、散剤、顆粒剤、シロップ剤、懸濁剤、カプセル剤、吸入剤、注射剤等が挙げられ、その製造のためには、これらの製剤に応じた各種担体を使用される。たとえば、経口剤の担体としては、賦形剤、結合剤、滑沢剤、流動性促進剤、着色剤を挙げることができる。吸入剤(たとえば、医薬組成物の粉末又は、医薬組成物を溶剤に溶かし又は懸濁した薬液をそのまま吸入するか、又はアトマイザーやネブライザーと呼ばれる噴霧器を用いて霧状にして吸入する方法などが挙げられる)とする場合には、たとえば、粉末として吸入させる場合には、上記固体の医薬組成物を調製する場合を参考とすることができ、さらに得られた粉末を微粉化することが好ましい。また液体として吸入させる場合には、上記を参考に調製した固体の医薬組成物を使用時に蒸留水や適当な溶剤に溶解して薬液を得る方法、または上記を参考に液体の医薬組成物を調製して薬液を得る方法などが好ましい。吸入される上記の粉末または薬液の大きさは吸入する際に適した粒子径が好ましく、たとえば上限は100  $\mu$ m以下が好ましく、さらに好ましくは50  $\mu$ m以下、特に好ましくは10  $\mu$ m以下が挙げられる。また、下限は特

に制限はなく、粒子径は小さいことが好ましい。また、注射剤等とする場合には、希釈剤として一般に注射用蒸留水、生理食塩水、ブドウ糖水溶液、注射用植物油、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール等を使用することができる。さらに必要に応じて、殺菌剤、防腐剤、安定剤、等張化剤、無痛化剤等を加えてもよい。

#### 【0374】

上記の予防及び／又は治療剤を投与する際には、適切な剤形を適宜選択して、適切な経路で投与すればよい。たとえば、錠剤、散剤、顆粒剤、シロップ剤、懸濁剤、カプセル剤の形で経口投与することができる。また、吸入剤の形で経気道的に投与することができる。また、点滴を含む注射剤の形で皮下、皮内、血管内、筋肉内又は腹腔内に投与することができる。さらには、舌下剤、坐剤の形で経粘膜的に投与することができ、ゲル剤、ローション剤、軟膏剤、クリーム又はスプレーの形で経皮的に投与することができる。その投与量は、投与形態、患者の年齢、体重、症状の度合いなどによって異なるが、一般的には成人1日当たり1～1000mgを1～3回に分けて投与することが例示される。投与期間は数日～2カ月の連日投与が一般的であるが、患者の症状により1日投与量、投与期間共に増減することができる。

#### 【0375】

上記の予防及び／又は治療剤を使用するに際しては、通常のとおり、肺線維症の患者に投与することの他、肺線維症を副作用として誘起する可能性のある薬剤の投与後、特に好ましくは投与直後に、4型PLA<sub>2</sub>阻害剤を有効成分とする本発明の予防及び／又は治療剤を投与することも好ましい。さらに、その投与時期としては、本発明の予防及び／又は治療剤は、肺線維症を副作用として誘起する可能性のある薬剤と同時に投与することも出来、さらには事前に投与することも可能である。

#### 【実施例】

##### 【0376】

次に実施例及び試験例等により本発明をさらに具体的に説明するが、本発明の範囲は下記の実施例等に限定されることはない。実施例中、薄層クロマトグラフィー(TLC)はPrec coated silica gel 60 F254 (メルク社製、製品番号5715-1M)を使用した。クロロホルム：メタノール(1：0～1：1)、アセトニトリル：酢酸：水(200：1：1～100：4：4)、または、酢酸エチル：ヘキサン(1：0～0：1)により展開後、UV(254nm)照射、ニンヒドリンまたはジニトロフェニルヒドラジン塩酸溶液による呈色により確認した。有機溶媒の乾燥には無水硫酸マグネシウムあるいは無水硫酸ナトリウムを使用した。カラムクロマトグラフィーのうち「Quad」と記載したものについてはQuad1分取システム(Biotage社製)を用い、カラムは同社製KP-Sil-12M、40Sまたは40Mのいずれかのカートリッジカラムを試料の量に応じて1本または数本使用した。フラッシュカラムクロマトグラフィーはシリカゲル60N(球状、中性、40～100μm、関東化学社製)を使用した。分取薄層クロマトグラフィー(以下、「PTLC」と略す)はPLCプレートsilica gel 60 F254、20×20cm、層厚2mm、濃縮ゾーン(4cm)付(メルク社製、製品番号13793-1M)を試料の量に応じて1枚または数枚使用して行った。

##### 【0377】

「LCMS」については液体クロマトグラフ質量分析スペクトル(LC-MS)にてマススペクトルを測定した。質量分析装置としてPlatform-LC型質量分析装置[マイクロマス(Micromass)社製]を用いエレクトロスプレー(ESI)法により測定した。液体クロマト装置はギルソン(GILSON)社製の装置を使用した。分離カラムはMightysil RP-18 GP50-4.6(関東化学社製)を用いた。溶出は一般には、流速2ml/分、溶媒としてA液=水[0.1%(v/v)酢酸含有]、B液=アセトニトリル[0.1%(v/v)酢酸含有]を用いた。

##### 【0378】

後述の表中に示した「LCMS」とは、液体クロマトグラフ質量分析スペクトルのデー

タを示す。「Mass」の欄にはマススペクトルのデータを示した(ただし「N. D」と記したものについては分子イオンピークが検出できなかったことを意味する)。「method」の欄には液体クロマトの溶出条件を記した。「RT time」の欄には液体クロマトの保持時間を記した。液体クロマトの保持時間を示す場合、溶出条件を「A」と記載したものは、0分から5分までB液を5~100% (v/v) 直線グラジエントしたのち6分までB液を100%で溶出した条件で測定したことを示す。同様に溶出条件を「B」と記載したものは、0分から0.5分までB液30% (v/v) で溶出した後、0.5分から4分までB液を30~95% (v/v) 直線グラジエントし、さらに6分までB液を95% (v/v) で溶出した条件で測定したことを示す。また溶出条件の欄に「C」と示したものについては、「Mass」の欄にJEOL-JMS-SX102 (日本電子社製) を用い、高速原子衝突マススペクトラム (FAB-MS) により測定したマススペクトルのデータを記した。

**【0379】**

後述の表中に示した、「Exp.」と記す欄には化合物番号を記入した。「position」と示した欄がある場合、その欄には置換基の置換位置を示す。また表中の略号は下記の意味を示す。
































n: ノルマル、i: イソ、s: セカンダリー、t: ターシャリー、c: シクロ、D: ジ、Me: メチル、Et: エチル、Pr: プロピル、Bu: ブチル、Pen: ペンチル、Hex: ヘキシル、Hep: ヘプチル、Ph: フェニル、Bn: ベンジル、Py: ピリジル、Indan: インダニル、Ac: アセチル、CHO: ホルミル、COOH: カルボキシル、NO<sub>2</sub>: ニトロ、DMA: ジメチルアミノ、NH<sub>2</sub>: アミノ、CF<sub>3</sub>: トリフルオロメチル、F: フルオロ、Cl: クロロ、Br: ブロモ、OMe: メトキシ、OH: ヒドロキシ、TFA: トリフルオロアセチル、SO<sub>2</sub>: スルホニル、CO: カルボニル、Nap: ナフチル、Ind: 1H-インドリル、1HIndz: 1H-インダゾリル、2HIndz: 2H-インダゾリル、Bzt: ベンゾチアゾール、2ABzt: 2-アミノベンゾチアゾール、BF: ベンゾフラニル、BT: ベンゾ [b] チエニル、Qu: キノリル、IQ: イソキノリル。

**【0380】**

各置換基の前に付与した数字は置換位置を示す。また芳香環の略号の前にハイフンで付与した数字はその芳香環の置換位置を表す。(S)は光学活性のS体を(R)はR体を示す。表中の置換基のうち略号で示したものの代表例を下記表2に示す。

**【0381】**

【表 2】

Structure	abbreviation	Structure	abbreviation	Structure	abbreviation
	cPenMeO		cHexMeO		iBuO
	2EtBuO		2,3DMeBuO		cPenO
	cHexO		cHepO		BnO
	(R)1PhEtO		2ClBnO		4FBnO
	2-IndanO		2(4FPh)EtO		2(4DMAPh)EtO
	2(3-Py)EtO		2(PhO)EtO		3F,4(OMe)BnO
			2-Nap		1-Nap
	5-Ind		1Me-5-Ind		5-1HIdz
	1Me-5-1HIdz		5-Bzt		5-2ABzt
	2Me-5-Bzt		5-BT		5-BF
	3-Qu		6-IQ		

使用した試薬の製造元については以下の略号で示す場合がある。東京化成社製；「TCI」、アルドリッチ社製；「Al d」、関東化学社製；「KANTO」、和光純薬社製；「WAKO」、ランカスター社製；「LANC」、Maybridge社製；「MAYB」。

## 【0382】

## 【実施例A-1】

3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体1)の合成

あらかじめメタノール(250ml)に氷冷下、塩化チオニル(18.3ml、WAKO)を滴下し混合した溶液に3-(4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸(16.6g、TCI)のメタノール(50ml)溶液を氷冷下滴下し30分撹拌した後、室温まで昇温し、さらに1時間半撹拌した。反応混合液を減圧下濃縮した後、ジエチルエーテル(200ml)で抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去し標記化合物(中間体1; 17.95g)を得た。

## 【0383】

3-(4-シクロペンチルメチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体2)の合成

シクロペンタンメタノール(4.05ml、Al d)の無水テトラヒドロフラン(以下、「THF」と略す)(40ml)溶液に、トリエチルアミン(6.49ml、WAKO)を加え、メタンスルホンクロリド(3.48ml、WAKO)を氷冷下滴下し30分撹拌した。反応混合液に水(50ml)を加えジエチルエーテル(80ml×2)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。あらかじめ中間体1(4.50g)のN,N-ジメチルホルムアミド(以下、「DMF」と略す)(35ml)溶液に氷冷下、60%水素化ナトリウム(1.15g、KANTO)を加え15分撹拌しておいた溶液に前述の残渣のDMF(10ml)溶液を氷冷下加えた。15分撹拌後室温

に昇温して45分攪拌した後、60℃でさらに15時間攪拌した。反応混合液に水(100ml)およびジエチルエーテル(200ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:イソプロピルエーテル=9:1)で精製し標記化合物(中間体2; 5.58g)を得た。

#### 【0384】

3-(3-ブロモ-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号A-1)の合成

中間体2(1.31g)のアセトニトリル(50ml)溶液に、N-プロモスクシンイミド(以下、「NBS」と略す)(979mg、KANTO)を加え室温にて2時間攪拌した後、40℃に昇温して3時間攪拌した。減圧下濃縮した後、酢酸エチル(200ml)を加え、飽和塩化アンモニウム水溶液、5%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去し標記化合物(化合物番号A-1; 1.69g)を得た。

#### 【0385】

##### 〔実施例A-2〕

3-(3-ブロモ-4-メトキシフェニル)プロピオン酸(中間体3)の合成

化合物番号A-1の合成法に記載の手順に従って3-(4-メトキシフェニル)プロピオン酸(27.0g、TCI)およびNBS(29.4g)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体3; 38.1g)を得た。ただし反応は氷冷下にて30分間、室温にて3時間行った。

#### 【0386】

3-(3-ブロモ-4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸(中間体4)の合成

文献[M. C. Carrenoら、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J. Org. Chem.)、1995年、60巻、5328頁]に記載の手順に従って、中間体4(23.5g)の塩化メチレン(200ml)溶液を1M三臭化ホウ素/塩化メチレン溶液(200ml、Fluka社製)に-78℃で滴下し、30分後室温まで昇温しさらに1時間半攪拌した。反応混合液を氷水(750ml)に注ぎ、室温にて1時間攪拌した。反応混合液にジエチルエーテル(750ml)を加え抽出した。有機層に2規定水酸化ナトリウム水溶液(250ml×2)を加え抽出した後、水層を氷冷下5規定塩酸水溶液で酸性にし、再びジエチルエーテル(375ml×2)にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去し標記化合物(中間体4; 23.5g)を得た。

。

#### 【0387】

3-(3-ブロモ-4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体5)の合成  
中間体1の合成法に記載の手順に従って中間体4(21.15g)および塩化チオニル(15.0ml)をメタノール中、反応させ処理することにより標記化合物(中間体5; 20.36g)を得た。ただし精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)にて行った。

#### 【0388】

(3-ブロモ-4-シクロヘキシルメチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号A-2)の合成

中間体5(1.29g)のDMF(25ml)溶液に、炭酸カリウム(0.86g)およびプロモメチルシクロヘキサン(1.05ml、TCI)を加え、アルゴン雰囲気下、室温にて2時間攪拌後60℃に昇温して17時間攪拌した。反応混合液を氷水に注ぎ、イソプロピルエーテル(200ml)で抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:イソプロピルエーテル=9:1)で精製し、標記化合物(化合物番号A-2; 1.45g)を得た。

#### 【0389】



## 〔実施例A-5〕

3-(3-ブromo-4-シクロペンチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号A-5)の合成

中間体5(4.50g)のDMF(20ml)溶液に氷冷下、60%水素化ナトリウム(440mg、KANTO)を加えた。10分攪拌後、臭化シクロペンタン(1.61ml、TCI)を加え室温に昇温して1時間半攪拌した後、60℃に昇温してさらに16時間攪拌した。反応混合液に水(50ml)およびイソプロピルエーテル(300ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:イソプロピルエーテル=7:1)で精製し、標記化合物(化合物番号A-5; 2.50g)を得た。

【0390】

## 〔実施例A-6〕

3-(3-ブromo-4-シクロヘキシルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号A-6)の合成

中間体5(2.06g)、トリフェニルホスフィン(以下、「Ph<sub>3</sub>P」と略す)(6.28g、WAKO)およびシクロヘキサノール(2.53ml、WAKO)の無水THF(60ml)溶液に氷冷下40%ジイソプロピルアゾジカルボン酸エステル/トルエン溶液(以下、「40%DIAD」と略す)(11.35ml、WAKO)を10分間かけ滴下した。10分間攪拌した後、室温に昇温して18時間半攪拌した。反応混合液に水(50ml)および酢酸エチル(200ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:イソプロピルエーテル=8:1)で精製し、標記化合物(化合物番号A-6; 2.35g)を得た。

【0391】

## 〔実施例A-20〕

3-(3-ブromo-5-クロロ-4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体6)の合成

中間体5(516mg)のクロロホルム(5ml)溶液に塩化スルフリル(177μl)を加え室温にて21時間攪拌した。反応混合液を飽和重曹水(20ml)に注ぎ酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標記化合物(中間体6; 290mg)を得た。

3-(3-ブromo-5-クロロ-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号A-20)の合成

化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従って中間体6(278mg)、Ph<sub>3</sub>P(747mg)、シクロペンタンメタノール(308μl)、および40%DIAD(1.34ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A-20; 337mg)を得た。ただし精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=30:1)にて行った。

【0392】

## 〔実施例A-21〕

3-(3-フルオロ-4-メチルオキシフェニル)アクリル酸エチル(中間体7)の合成  
3-フルオロ-4-メトキシベンズアルデヒド(2.20g、Alid)の1,2-ジエトキシエタン(5ml)溶液に、ジエチルホスホ酢酸エチル(3.12ml、TCI)を加え、氷冷下60%水素化ナトリウム(624mg)を加えた。10分間攪拌した後、室温に昇温して5時間攪拌した。反応混合液に酢酸エチル(90ml)を加え、飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸

エチル=10:1)で精製し、標記化合物(中間体7; 3.16g)を得た。

3-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)プロピオン酸エチル(中間体8)の合成

中間体7(3.01g)の酢酸エチル(50ml)/メタノール(25ml)混合溶液に10%パラジウム炭素(300mg、メルク社製)を加え、水素雰囲気下室温にて2時間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去して標記化合物(中間体8; 3.02g)を得た。

#### 【0393】

3-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)プロピオン酸(中間体9)の合成

中間体8(2.97g)のメタノール(40.0ml)溶液に2規定水酸化ナトリウム水溶液(15.0ml)を加え、60℃で16時間攪拌した。反応混合液を減圧下濃縮した後、氷冷下5%塩酸水で酸性にし酢酸エチル(200ml)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、溶媒を減圧下留去して標記化合物(中間体9; 2.40g)を得た。

#### 【0394】

3-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸(中間体10)の合成

ピリジンおよび濃塩酸(各30ml)を混合した後、190℃で1時間加熱することで調製したピリジン/塩酸錯体に中間体9(2.40g)を加え、190℃で1時間半攪拌した。反応混合液を氷冷した1規定塩酸100mlに注ぎ、酢酸エチル(200ml)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去して標記化合物(中間体10; 1.98g)を得た。

#### 【0395】

3-(3-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体11)の合成

中間体1の合成法に記載の手順に従って中間体10(1.77g)および塩化チオニル(1.65ml)をメタノール中反応させ処理することにより標記化合物(中間体11; 1.85g)を得た。

#### 【0396】

3-(3-ブロモ-5-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体12)の合成

化合物番号A-1の合成法に記載の手順に従って中間体11(1.84g)およびNBS(1.74g)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体12; 1.74g)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は氷冷下で2時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて行った。

#### 【0397】

3-(3-ブロモ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-フルオロフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号A-21)の合成

化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従って中間体11(310mg)、 $\text{Ph}_3\text{P}$ のかわりにトリブチルホスフィン(以下、「 $\text{Bu}_3\text{P}$ 」と略す)(405 $\mu\text{l}$ 、WAKO)、シクロペンタンメタノール(176 $\mu\text{l}$ )、および40%DIADのかわりにN, N, N', N'-テトラメチルアゾジカルボキシアミド(以下、「TMAD」と略す)(279mg、TCI)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号A-21; 386mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は22時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=50:1)にて行った。

#### 【0398】

##### 〔実施例A-24〕

4-シクロペンチルオキシ-3-メチルベンズアルデヒド(中間体13)の合成

化合物番号A-2の合成法に記載の手順に従って4-ヒドロキシ-3-メチルベンズアルデヒド(283mg、TCI)、炭酸カリウム(578mg)およびプロモシクロペンタン(430 $\mu\text{l}$ )を反応させ処理することにより標記化合物(中間体13; 350mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は16時間行った。精製はカラムクロマトグラ

フィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=9:1) にて行った。

【0399】

3-(4-シクロペンチル-3-メチルフェニル) アクリル酸エチル (中間体14) の合成

中間体7の合成法に記載の手順に従って中間体13 (342 mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル (408  $\mu$ l) および60%水素化ナトリウム (82 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体14; 450 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=9:1) にて行った。

【0400】

3-(4-シクロペンチル-3-メチルフェニル) プロピオン酸エチル (中間体15) の合成

中間体8の合成法に記載の手順に従って中間体14 (446 mg) および10%パラジウム炭素 (20 mg) を水素ガス雰囲気下反応させ処理することにより標記化合物 (中間体15; 439 mg) を得た。

【0401】

3-(3-ブロモ-4-シクロペンチル-5-メチルフェニル) プロピオン酸エチル (化合物番号A-24) の合成

化合物番号A-1の合成法に記載の手順に従って中間体15 (437 mg) およびNBS (320 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号A-24; 545 mg) を得た。

【0402】

【実施例A-25】

3-ブロモ-4-(*t*-ブチルジメチルシリルオキシ)-5-メトキシベンズアルデヒド (中間体16) の合成

3-ブロモバニリン (1.16 g、TCI) の無水DMF (20 ml) 溶液にイミダゾール (408 mg、TCI) を加え、4-(*N,N*-ジメチルアミノ) ピリジン (25 mg)、*t*-ブチルジメチルシリルクロリド (904 mg、TCI) のDMF (15 ml) 溶液を氷冷下滴下し30分攪拌した後、室温に昇温しさらに3時間攪拌した。反応混合液に水 (100 ml) を加え酢酸エチル (100 ml) で抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=9:1) で精製し、標記化合物 (中間体16; 1.75 g) を得た。

【0403】

3-[3-ブロモ-4-(*t*-ブチルジメチルシリルオキシ)-5-メトキシフェニル] アクリル酸エチル (中間体17) の合成

中間体7の合成法に記載の手順に従って中間体16 (910 mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル (530  $\mu$ l) および60%水素化ナトリウム (120 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体17; 937 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は1時間半行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=9:1) にて行った。

【0404】

3-[3-ブロモ-4-(*t*-ブチルジメチルシリルオキシ)-5-メトキシフェニル] プロピオン酸エチル (中間体18) の合成

中間体8の合成法に記載の手順に従って中間体17 (945 mg) および10%パラジウム炭素 (95 mg) を水素ガス雰囲気下反応させ処理することにより標記化合物 (中間体18; 760 mg) を得た。

【0405】

3-(3-ブロモ-4-ヒドロキシ-5-メトキシフェニル) プロピオン酸エチル (中間体19) の合成

中間体18 (750 mg) のTHF (50 ml) 溶液に、テトラブチルアンモニウムフルオリド/THF 1M溶液 (5 ml、TCI) を加え1時間半撹拌した。反応混合液に飽和重曹水 (30 ml) を加え酢酸エチル (50 ml) で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) で精製し、標記化合物 (中間体19; 542 mg) を得た。

## 【0406】

3- (3-プロモ-4-シクロペンチルオキシ-5-メトキシフェニル) プロピオン酸エチル (化合物番号A-25) の合成

化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従って中間体19 (400 mg)、 $\text{Ph}_3\text{P}$  (1.31 g)、シクロペンタノール (450  $\mu\text{l}$ ) およびTMAD (860 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号A-25; 376 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は16時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル=7:1) にて行った。

## 【0407】

## 〔実施例A-26〕

3- (3-プロモ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-ニトロフェニル) プロピオン酸メチル (化合物番号A-26) の合成

あらかじめ無水酢酸 (30 ml) に氷冷下70%硝酸 (3.9 ml) を加え10分間撹拌した溶液に化合物番号A-1 (5.12 g) のアセトニトリル (25 ml) 溶液を-15℃で15分間かけて滴下し15分撹拌した。反応混合液を氷を入れた1規定水酸化ナトリウム水溶液 (500 ml) に注ぎ、ジエチルエーテル (300 ml  $\times$  2) にて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル=10:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号A-26; 3.68 g) を得た。

## 【0408】

## 〔実施例A-31〕

3- (3-プロモ-4-フェノキシフェニル) プロピオン酸メチル (化合物番号A-31) の合成

中間体5 (3.08 g) の無水N-メチルピロリドン (9.5 ml、WAKO) 溶液に炭酸セシウム (3.58 g、WAKO)、ヨウ化ベンゼン (1.4 ml、TCI)、ジピバロイルメタン (0.12 ml、TCI) 及び塩化銅 (I) (275 mg、WAKO) を順次加え、アルゴンガス雰囲気下、120℃で16時間撹拌した。反応混合液にt-ブチルメチルエーテル (25 ml) を加え、不溶物をろ取した。ろ液を2規定塩酸水および飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=1:10) で精製し、標記化合物 (化合物番号A-31; 1.00 g) を得た。

## 【0409】

## 〔実施例B-96〕

3- (3-プロモ-4-メトキシフェニル) プロピオン酸メチル (中間体20) の合成  
中間体1の合成法に記載の手順に従って中間体3 (1.60 g) および塩化チオニル (1.44 ml) をメタノール中反応させ処理することにより標記化合物 (中間体20; 1.63 g) を得た。ただし精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=6:1) にて行った。

## 【0410】

3- (3-プロモ-4-メトキシ-5-ニトロフェニル) プロピオン酸メチル (中間体21) の合成

中間体20 (3.20 g) の無水酢酸 (25 ml) 溶液に氷冷下、硝酸カリウム (1.30 g) を加え10分間撹拌した溶液に濃硫酸 (730  $\mu\text{l}$ ) を10分間かけて滴下した。そのまま10分撹拌した後、室温に昇温しさらに30分撹拌した。反応混合液を氷を入れた1規定水酸化ナトリウム水溶液 (250 ml) に注ぎ、イソプロピルエーテル (200

ml×2)にて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標記化合物 (中間体21; 2.73g)を得た。

**【0411】**

3-(3-プロモ-4-メトキシ-5-ニトロフェニル)プロピオン酸 (中間体22) の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って中間体21 (12.73g) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (40ml)を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体22; 11.53g)を得た。ただし反応は1時間行った。

**【0412】**

3-(3-プロモ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)プロピオン酸 (中間体23) の合成

中間体4の合成法に記載の手順に従って中間体22 (11.53g) および1M三臭化ホウ素/塩化メチレン溶液 (100ml)を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体23; 10.68g)を得た。ただし反応は2時間行った。

**【0413】**

3-(3-プロモ-4-ヒドロキシ-5-ニトロフェニル)プロピオン酸メチル (中間体24) の合成

中間体1の合成法に記載の手順に従って中間体23 (10.68g) および塩化チオニル (8.06ml)を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体24; 8.27g)を得た。ただし反応は17時間半行った。

**【0414】**

3-[3-プロモ-4-(インダン-2-イルオキシ)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号B-96) の合成

化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従って中間体24 (151mg)、Ph<sub>3</sub>P (260mg)、2-ヒドロキシインダン (133mg、TCI) および40%DIAD (470μl)を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号B-96; 192mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は15時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=19:1)にて行った。

**【0415】****【実施例B-99】**

3-(3-アミノ-5-プロモ-4-シクロペンチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル (化合物番号B-99) の合成

化合物番号A-28 (416mg)のTHF (5ml)/メタノール (5ml)混合溶液にラネ-2800ニッケル (230mg、Ala)を加え、水素雰囲気下室温にて6時間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:2)にて精製し標記化合物 (化合物番号B-99; 143mg)を得た。

**【0416】****【実施例B-103】**

3-[4-ベンジルオキシ-5-プロモ-3-(2,2,2-トリフルオロアセチルアミノ)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号B-103) の合成

化合物番号B-100 (58.7mg)の塩化メチレン (2ml)溶液にトリエチルアミン (76μl)を加え、無水トリフルオロ酢酸 (91μl、TCI)を氷冷下滴下し30分攪拌した後、室温に昇温しさらに2時間攪拌した。反応混合液に水 (5ml)を加え塩化メチレン (20ml)で抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=3:1)で精製し、標記化合物 (化合物番号B-103; 59.1mg)を得た。

**【0417】**

## 【実施例 B-105】

3-[4-ベンジルオキシ-5-ブロモ-3-(N-メチルアミノ)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号B-105)の合成

化合物番号B-100(105mg)のDMF(3ml)溶液に氷冷下60%水素化ナトリウム(20mg)を加え10分間攪拌した。これにヨウ化メチル(32 $\mu$ l)を滴下して10分攪拌した後、室温に昇温しさらに2時間攪拌した。反応混合液を水に注ぎ酢酸エチル(30ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1)で精製し、標記化合物(化合物番号B-105;17mg)を得た。

## 【0418】

## 【実施例 B-109】

3-[4-ベンジルオキシ-5-ブロモ-3-(N,N-ジメチルアミノ)フェニル]プロピオン酸(化合物番号B-109)の合成

化合物番号B-100(105mg)のDMF(3ml)溶液に氷冷下60%水素化ナトリウム(40mg)を加え10分間攪拌した。これにヨウ化メチル(300 $\mu$ l)を滴下して10分攪拌した後、室温に昇温しさらに16時間攪拌した。反応混合液を水に注ぎ酢酸エチル(30ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1)で精製し、標記化合物(化合物番号B-109;88mg)を得た。

## 【0419】

## 【実施例 B-113、B-114】

3-(3-ブロモ-4-シクロペンチルオキシ-5-ヒドロキシフェニル)プロピオン酸(化合物番号B-113)及び3-(5-アセトキシ-3-ブロモ-4-シクロペンチルオキシフェニル)プロピオン酸(化合物番号B-114)の合成

化合物番号B-99(415mg)の酢酸(1.5ml)溶液に20%硫酸(1.0ml)を加えた。ここに亜硝酸ナトリウム(78mg)の水溶液(0.5ml)を反応液温10℃以下に保ちながら10分間かけて滴下し更に5分間攪拌した。この反応溶液をあらかじめ酢酸ナトリウム(348mg)の酢酸溶液(3.5ml)を100℃に加熱攪拌しておいたものに5分間かけて滴下し、更に10分間加熱攪拌した。反応溶液を氷水(50ml)に注ぎイソプロピルエーテル(100ml $\times$ 2)にて抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標記化合物(化合物番号B-113;47mgおよび化合物番号B-114;105mg)を得た。

## 【0420】

## 【実施例 B-117】

3-(3,5-ジブロモ-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(化合物番号B-117)の合成

中間体1(670mg)のアセトニトリル(30ml)溶液に、NBS(990mg)を加え、室温にて2時間攪拌した後40℃に昇温して18時間攪拌した。減圧下濃縮した後、酢酸エチル(100ml)を加え、飽和塩化アンモニウム水溶液、5%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣を化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従ってPh<sub>3</sub>P(1460mg)、シクロペンタンメタノール(560mg)および40%DIAD(2.6ml)を反応させ処理することにより標記化合物標記化合物(化合物番号B-117;710mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は氷冷下で18時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて行った。

## 【0421】

## 〔実施例 A-1 ~ 33〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-A-1 に示す。化合物の製造は、表中の「Syn」の欄に示した化合物番号（例えば「A-1」）あるいは中間体番号（例えば「Int 2」）の化合物の製造方法に準じて行った。「Int」は中間体番号を意味する。製造が複数の工程に渡る場合、該当する化合物番号あるいは中間体番号を併記した。例えば「Syn」の欄に「Int 2, A-1」と記載された場合、これは「中間体 2 の合成法に記載の手順に従って製造された化合物から、化合物番号 1 の合成法に記載の手順に従って製造した」ということを意味する。また、化合物番号 A-6 の合成法に記載の手順に従って合成する場合、40% DIAD の代わりに TMAD あるいはジ-tert-ブチルアゾジカルボキシレート（以下、「DBAB」と略す）を用いる場合もある。

【0422】

【表 3】

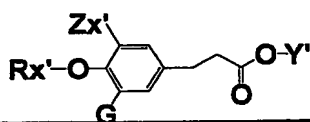


Table-A-1

Exp.	Rx'O	Y'	Zx'	G	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
A-1	cPenMeO	Me	H	Br	A-1	C		341 (M <sup>+</sup> +1)
A-2	cHexMeO	Me	H	Br	A-2	C		354 (M <sup>+</sup> )
A-3	iBuO	Me	H	Br	A-2	A	5.34	N.D
A-4	2EtBuO	Me	H	Br	A-2			
A-5	cPenO	Me	H	Br	A-5	C		326 (M <sup>+</sup> )
A-6	cHexO	Me	H	Br	A-6	C		340 (M <sup>+</sup> )
A-7	cHepO	Me	H	Br	A-6			
A-8	BnO	Me	H	Br	A-2			
A-9	1PhEtO	Me	H	Br	A-2			
A-10	2FBnO	Me	H	Br	A-2			
A-11	4FBnO	Me	H	Br	A-2			
A-12	2ClBnO	Me	H	Br	A-2			
A-13	4ClBnO	Me	H	Br	A-2	A	4.85	N.D
A-14	4MeBnO	Me	H	Br	A-2			
A-15	4CF3BnO	Me	H	Br	A-2			
A-16	2(4DMAPh)EtO	Me	H	Br	A-6			
A-17	2(PhO)EtO	Me	H	Br	A-6	A	5.04	N.D
A-18	1(2FPh)EtO	Me	H	Br	A-6			
A-19	1(4ClPh)EtO	Me	H	Br	A-6	A	4.82	N.D
A-20	cPenMeO	Me	Cl	Br	A-20	C		375 (M <sup>+</sup> +1)
A-21	cPenMeO	Me	F	Br	A-21			
A-22	cPenO	Me	F	Br	A-21	C		345 (M <sup>+</sup> +1)
A-23	cHexO	Me	F	Br	A-21			
A-24	cPenO	Et	Me	Br	A-24	A	5.82	N.D
A-25	cPenO	Et	OMe	Br	A-25			
A-26	cPenMeO	Me	NO <sub>2</sub>	Br	A-26	C		340 (M <sup>+</sup> +1)
A-27	cHexMeO	Me	NO <sub>2</sub>	Br	A-26			
A-28	cPenO	Me	NO <sub>2</sub>	Br	A-26	C		372 (M <sup>+</sup> +1)
A-29	cHexO	Me	NO <sub>2</sub>	Br	A-26			
A-30	2-IndanO	Me	NO <sub>2</sub>	Br	A-26	A	5.03	N.D
A-31	PhO	Me	H	Br	A-31	A	5.15	N.D
A-32	4ClPhO	Me	H	Br	A-31	A	5.47	N.D
A-33	4MeOPhO	Me	H	Br	A-31	A	5.02	N.D

## 〔実施例 B-1 ~ 119〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-B-1 ~ 3 に示す

【0423】

【表4】

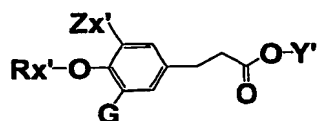


Table-B-1

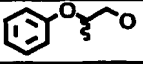





Exp.	Rx'O	Y'	Zx'	G	Syn	LCMS		
						method	RTtime	Mass
B-1	nPrO	Me	H	Br	A-2	C		279 (M <sup>+</sup> )
B-2	iPrO	Me	H	Br	A-2			
B-3	sBuO	Me	H	Br	A-6			
B-4	iPenO	Me	H	Br	A-6			
B-5	1,3DMeBuO	Me	H	Br	A-6			
B-6	2MeBuO	Me	H	Br	A-6			
B-7		Me	H	Br	A-6			
B-8		Me	H	Br	A-6			
B-9	2,3DMeBuO	Me	H	Br	A-6			
B-10	cPenO	Me	H	Cl	A-6	C		361 (M <sup>+</sup> +1)
B-11	trans2Me,cPenO	Me	H	Br	A-6			
B-12	3Me,cPenO	Me	H	Br	A-6			
B-13	trans2Me,cHexO	Me	H	Br	A-6			
B-14	cis2Me,cHexO	Me	H	Br	A-6			
B-15	3Me,cHexO	Me	H	Br	A-6	C		354 (M <sup>+</sup> +1)
B-16	4Me,cHexO	Me	H	Br	A-6			
B-17	2,3DMe,cHexO	Me	H	Br	A-6			
B-18	3,4DMe,cHexO	Me	H	Br	A-6	C		368 (M <sup>+</sup> +1)
B-19	3,5DMe,cHexO	Me	H	Br	A-6			
B-20		Me	H	Br	A-6			
B-21		Me	H	Br	A-6			
B-22		Me	H	Br	A-6			
B-23	1PhPrO	Me	H	Br	A-6			
B-24	(S)1PhPrO	Me	H	Br	A-6			
B-25	BenzhydrylO	Me	H	Br	A-6			
B-26		Me	H	Br	A-6	C		391 (M <sup>+</sup> +1)
B-27		Me	H	Br	A-6			
B-28	2Ph,1MeEtO	Me	H	Br	A-6			
B-29	2Ph,2MeEtO	Me	H	Br	A-6			
B-30	2(2FPh),1MeEtO	Me	H	Br	A-6			
B-31	2(3CF <sub>3</sub> Ph),1MeEtO	Me	H	Br	A-6			
B-32	3PhBuO	Me	H	Br	A-6			
B-33	5OMe-2-IndanO	Me	H	Br	A-6			
B-34	5,6D(OMe)-2-IndanO	Me	H	Br	A-6			
B-35	5F-2-IndaneO	Me	H	Br	A-6			
B-36	1-IndaneO	Me	H	Br	A-6			
B-37		Me	H	Br	A-6			

【0424】



【表 5】

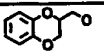
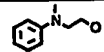
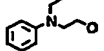
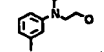
Table-B-2

B-38		Me	H	Br	A-6			
B-39	3FBnO	Me	H	Br	A-6			
B-40	2MeBnO	Me	H	Br	A-6	C		363 (M <sup>+</sup> +1)
B-41	3MeBnO	Me	H	Br	A-6			
B-42	3,5DMeBnO	Me	H	Br	A-6			
B-43	4tBuBnO	Me	H	Br	A-6			
B-44	2CF <sub>3</sub> BnO	Me	H	Br	A-6			
B-45	4CF <sub>3</sub> BnO	Me	H	Br	A-6			
B-46	3(CF <sub>3</sub> O)BnO	Me	H	Br	A-6			
B-47	4(CF <sub>3</sub> O)BnO	Me	H	Br	A-6			
B-48	4(nBuO)BnO	Me	H	Br	A-6			
B-49		Me	H	Br	A-6	C		406 (M <sup>+</sup> +1)
B-50	3,4DFBnO	Me	H	Br	A-6			
B-51	2,4DFBnO	Me	H	Br	A-6			
B-52	4Br,2FBnO	Me	H	Br	A-6			
B-53	2,4DCIBnO	Me	H	Br	A-6			
B-54	3,4DCIBnO	Me	H	Br	A-6			
B-55	2,3DCIBnO	Me	H	Br	A-6			
B-56	2,6DCIBnO	Me	H	Br	A-6			
B-57	3,5DCIBnO	Me	H	Br	A-6			
B-58	2-NapMeO	Me	H	Br	A-6	C		399 (M <sup>+</sup> +1)
B-59	1-NapMeO	Me	H	Br	A-6			
B-60		Me	H	Br	A-6			
B-61		Me	H	Br	A-6			
B-62		Me	H	Br	A-6	C		339 (M <sup>+</sup> +1)
B-63	2PhBnO	Me	H	Br	A-6			
B-64	4PhBnO	Me	H	Br	A-6			
B-65	2PhEtO	Me	H	Br	A-6			
B-66	2(2MePh)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-67	2(3MePh)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-68	2(4MePh)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-69	2(3FPh)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-70	2(3ClPh)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-71	2(2CF <sub>3</sub> Ph)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-72	2(4CF <sub>3</sub> Ph)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-73	2(2OMePh)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-74	2(2-Nap)EtO	Me	H	Br	A-6	C		413 (M <sup>+</sup> +1)
B-75	2(3-Ind)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-76		Me	H	Br	A-6			
B-77	2(PhO)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-78	2(2ClPhO)EtO	Me	H	Br	A-6			
B-79	2(4ClPhO)EtO	Me	H	Br	A-6			

【0425】

【表 6】

Table-B-3

B-80		Me	H	Br	A-6	C		407 (M <sup>+</sup> +1)
B-81		Me	H	Br	A-6			
B-82		Me	H	Br	A-6			
B-83		Me	H	Br	A-6			
B-84	2(PhS)EtO	Me	H	Br	A-6	C		379 (M <sup>+</sup> +1)
B-85	2-BztO	Me	H	Br	A-6			
B-86	(6OMe-2-Bzt)O	Me	H	Br	A-6			
B-87	cPenO	Me	Cl	Br	A-20			
B-88	1(4FPh)EtO	Me	Cl	Br	A-20			
B-89	1PhEtO	Me	F	Br	A-21			
B-90	1(4FPh)EtO	Me	F	Br	A-21			
B-91	1PhEtO	Et	Me	Br	A-24			
B-92	1(4FPh)EtO	Et	Me	Br	A-24			
B-93	1PhEtO	Me	OMe	Br	A-25			
B-94	1(4FPh)EtO	Me	OMe	Br	A-25			
B-95	BnO	Me	NO2	Br	A-26			
B-96	2-IndanO	Me	NO2	Br	A-26	A	4.44	N.D
B-97	5OMe-2-IndanO	Me	NO2	Br	A-26			
B-98	4CF3BnO	Me	NO2	Br	A-26			
B-99	cPenO	Me	NH2	Br	B-99	C		342 (M <sup>+</sup> +1)
B-100	BnO	Me	NH2	Br	B-99			
B-101	1PhEtO	Me	NH2	Br	B-99			
B-102	5OMe-2-IndanO	Me	NH2	Br	B-99			
B-103	BnO	Me	NHTFA	Br	B-103			
B-104	cPenO	Me	NHTFA	Br	B-103	C		438 (M <sup>+</sup> +1)
B-105	BnO	Me	NHMe	Br	B-105			
B-106	cPenO	Me	NHMe	Br	B-105	C		356 (M <sup>+</sup> +1)
B-107	1PhEtO	Me	NHMe	Br	B-105			
B-108	1(4FPh)EtO	Me	NHMe	Br	B-105			
B-109	BnO	Me	NMe2	Br	B-109			
B-110	cPenO	Me	NMe2	Br	B-109	C		370 (M <sup>+</sup> +1)
B-111	1PhEtO	Me	NMe2	Br	B-109			
B-112	1(4FPh)EtO	Me	NMe2	Br	B-109			
B-113	cPenO	Me	OH	Br	B-113	C		343 (M <sup>+</sup> +1)
B-114	cPenO	Me	OCOMe	Br	B-114			
B-115	1(4FPh)EtO	Me	OH	Br	B-113			
B-116	1(4FPh)EtO	Me	OCOMe	Br	B-114			
B-117	cPenMeO	Me	Br	Br	B-117			
B-118	cPenO	Me	Br	Br	B-117	A	5.98	N.D
B-119	1(4FPh)EtO	Me	Br	Br	B-117			

## 【実施例 C-1】

3-プロモ-4-シクロヘキシルメチルオキシベンズアルデヒド (中間体 25) の合成  
 化合物番号 A-2 の合成法に記載の手順に従って 3-プロモ-4-ヒドロキシベンズアル  
 デヒド (17.4 g)、炭酸カリウム (23.9 g) およびプロモメチルシクロヘキサン  
 (36.2 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 25; 18.7 g)  
 を得た。ただし精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: イソプロピルエ  
 ーテル=5:1) にて行った。

## 【0426】

4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)ベンズアルデヒド (

## 化合物番号 C-1) の合成

2-ナフタレンボロン酸 (535 mg) のメタノール (5.0 ml) 溶液と中間体 25 (1.16 g)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (0.9 ml) をトルエン (10.0 ml) およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (0) [以下、「(Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd」と略す] (116 mg、ナカライテスク社製) を加え 80℃ で 17 時間攪拌した。反応混合液に酢酸エチル (100 ml) を加え、飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号 C-1; 345 mg) を得た。

【0427】

〔実施例 D-10〕

## 3-ブロモ-4-ヒドロキシ-5-ニトロベンズアルデヒド (中間体 26) の合成

3-ブロモ-4-ヒドロキシベンズアルデヒド (6.30 g) の酢酸 (45 ml) 溶液を水浴下、70%硝酸 (5.85 mL) を滴下し、その後、亜硝酸ナトリウム (62 mg) を加え、さらに 2 時間攪拌した。反応混合液を氷水 (300 ml) に注ぎ、沈殿を濾取、水 (50 ml × 3) にて洗浄した。沈殿物を減圧下 24 時間乾燥し標記化合物 (中間体 26; 5.88 g) を得た。

【0428】

## 3-ブロモ-4-シクロヘキシルメチルオキシ-5-ニトロベンズアルデヒド (中間体 27) の合成

化合物番号 A-2 の合成法に記載の手順に従って中間体 26 (5.5 g)、炭酸カリウム (3.94 g) およびプロモメチルシクロヘキサン (3.94 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 27; 5.2 g) を得た。ただし精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 7:1) にて行った。

【0429】

## 4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-ニトロベンズアルデヒド (化合物番号 D-10) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って中間体 27 (2.65 g)、2-ナフタレンボロン酸 (3.01 g)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (7.5 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (960 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 D-10; 2.96 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 80℃ で 15 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 7:1) にて行った。

【0430】

〔実施例 C-1 ~ 8〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-C-1 に示す。

【0431】

【表 7】

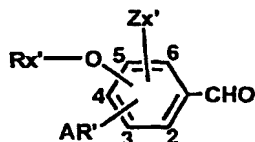


Table-C-1

Exp.	Rx'O	Rx'O Position	Zx'	Zx' Position	AR'	AR' Position	Syn	LCMS		
								method	RTime	Mass
C-1	cHexMeO	4	H	-	2-Nap	5	C-1			
C-2	cHexMeO	4	H	-	1-Nap	5	C-1			
C-3	cHexMeO	4	H	-	2OMe-6-Nap	5	C-1	C		374(M <sup>+</sup> )
C-4	cHexMeO	4	H	-	5-Ind	5	C-1			
C-5	cPenMeO	4	H	-	2-Nap	5	C-1			
C-6	cPenMeO	4	H	-	5-Ind	5	C-1			
C-7	cPenO	4	H	-	2-Nap	5	C-1	C		316(M <sup>+</sup> )
C-8	cPenO	4	H	-	5-Ind	5	C-1	C		305(M <sup>+</sup> )

## 【実施例 D-1 ~ 29】

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-D-1 に示す。

【0432】

【表 8】

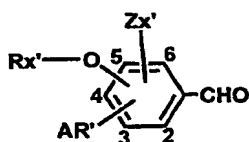


Table-D-1

Exp.	Rx'O	Rx'O Position	Zx'	Zx' Position	AR'	AR' Position	Syn	LCMS		
								method	RTime	Mass
D-1	cHexMeO	4	H	-	2-BT	3	C-1	C		350 (M <sup>+</sup> )
D-2	cHexMeO	4	H	-	2-BF	3	C-1			
D-3	cHexMeO	4	H	-	1Me-5-Ind	3	C-1	C		316(M <sup>+</sup> )
D-4	cHexMeO	4	H	-	5-1HIdz	3	C-1			
D-5	cHexMeO	4	H	-	1Me-5-1HIdz	3	C-1			
D-6	2(2FPh)EtO	4	H	-	2-Nap	3	C-1			
D-7	2(2FPh)EtO	4	H	-	5-Ind	3	C-1			
D-8	2-IndanO	4	H	-	5-Ind	3	C-1			
D-9	2-IndanO	4	H	-	5-1HIdz	3	C-1			
D-10	cPenMeO	4	NO2	5	2-Nap	3	D-10	C		330 (M <sup>+</sup> +1)
D-11	cPenMeO	4	NO2	5	5-Ind	3	D-10			
D-12	cHexMeO	4	NO2	5	2-Nap	3	D-10			
D-13	cHexMeO	4	NO2	5	2-BF	3	D-10			
D-14	cPenO	4	NO2	5	2-Nap	3	D-10			
D-15	cPenO	4	NO2	5	5-Ind	3	D-10	C		350(M <sup>+</sup> )
D-16	2(2FPh)EtO	4	NO2	5	2-Nap	3	D-10			
D-17	2(2FPh)EtO	4	NO2	5	5-Ind	3	D-10			
D-18	2-IndanO	4	NO2	5	5-Ind	3	D-10			
D-19	2-IndanO	4	NO2	5	1Me-5-1HIdz	3	D-10	A	3.85	414 (M <sup>+</sup> +1)
D-20	cPenO	2	H	-	2-Nap	5	C-1	C		316(M <sup>+</sup> )
D-21	cPenO	2	H	-	5-Ind	5	C-1	C		305(M <sup>+</sup> )
D-22	cPenO	3	H	-	2-Nap	5	C-1			
D-23	cPenO	3	H	-	5-Ind	5	C-1			
D-24	cPenO	5	H	-	2-Nap	2	C-1			
D-25	cPenO	5	H	-	5-Ind	2	C-1			
D-26	cPenO	4	H	-	2-Nap	2	C-1			
D-27	cPenO	4	H	-	5-Ind	2	C-1			
D-28	cPenO	3	H	-	2-Nap	2	C-1			
D-29	cPenO	3	H	-	5-Ind	2	C-1			

## 【実施例 E-1】

5-ブロモ-2-シクロペンチルメチルオキシピリジン (中間体 28) の合成  
 t-ブトキシカリウム (550.6 mg、WAKO) の脱水 THF (10 ml) 溶液にシ  
 クロペンタンメタノール (450 ul) を加えた後、氷冷下、2, 5-ジブロモピリジン  
 (982.8 mg、TCI) の脱水 THF 溶液 (15 ml) を加えた。30 分間攪拌した

後、室温に昇温して11時間攪拌した。反応混合液に水(100ml)及び酢酸エチル(60ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=15:1)で精製し、標記化合物(中間体28; 896mg)を得た。

#### 【0433】

2-シクロペンチルメチルオキシピリジン-5-カルバルデヒド(中間体29)の合成  
中間体28(895mg)の無水THF(10ml)溶液にアルゴンガス雰囲気下-78℃に冷却してn-ブチルリチウム/ヘキサン1.6M溶液(2.70ml、Ald)を5分かけて滴下し20分間攪拌した。ここに脱水DMF(330ul、WAKO)を3分かけて滴下し30分間攪拌した後、室温に昇温しさらに1時間攪拌した。反応混合液に水(10ml)を加え酢酸エチル(30ml×3)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標記化合物(中間体29; 1.04g)を得た。

#### 【0434】

3-(2-シクロペンチルメチルオキシピリジン-5-イル)アクリル酸エチル(中間体30)の合成

中間体7の合成法に記載の手順に従って、中間体29(450mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(530μl)および60%水素化ナトリウム(120mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体30; 394mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は1時間行った。

#### 【0435】

3-(6-2-シクロペンチルメチルオキシピリジン-5-イル)プロピオン酸エチル(中間体31)の合成

中間体8の合成法に記載の手順に従って、中間体30(392mg)および10%パラジウム炭素(30mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体31; 246mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は1時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=15:1)にて行った。

#### 【0436】

3-(3-プロモ-2-シクロペンチルメチルオキシピリジン-5-イル)プロピオン酸エチル(化合物番号E-1)の合成

中間体31(5.20g)のアセトニトリル(50ml)溶液を35℃に加熱し、臭素(1.1ml、WAKO)を滴下後、NBS(3.72g)を加え、室温にて2時間攪拌した。減圧下濃縮した後、酢酸エチル(200ml)を加え、飽和塩化アンモニア水溶液、5%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水および飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標記化合物(化合物番号E-1; 6.51g)を得た。

。

#### 【0437】

##### 〔実施例E-7〕

2-ベンジルオキシ-5-プロモピリジン(中間体32)の合成

中間体28の合成法に記載の手順に従って、t-ブトキシカリウム(3.13g)、ベンジルアルコール(3.10ml)および2,5-ジプロモピリジン(4.79g)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体32; 5.36g)を得た。ただし反応は1時間行った。

#### 【0438】

2-ベンジルオキシピリジン-5-カルバルデヒド(中間体33)の合成

中間体29の合成法に記載の手順に従って中間体32(5.10g)、n-ブチルリチウム/ヘキサン1.6M溶液(15.5ml)および脱水DMF(1.9ml)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体33; 2.75g)を得た。

3-(2-ベンジルオキシピリジン-5-イル)アクリル酸エチル(中間体34)の合成

中間体 7 の合成法に記載の手順に従って、中間体 33 (2.74 g)、ジエチルホスホノ酢酸エチル (3.12 ml) および 60% 水素化ナトリウム (635 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 34; 2.12 g) を得た。

【0439】

3-(2-ヒドロキシピリジン-5-イル) プロピオン酸エチル (中間体 35) の合成  
中間体 8 の合成法に記載の手順に従って、中間体 54 (2.12 g) および 10% パラジウム炭素 (120 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 35; 1.26 g) を得た。ただし反応は 2 時間半行った。

【0440】

3-(3-ブロモ-2-ヒドロキシピリジン-5-イル) プロピオン酸エチル (中間体 36) の合成  
化合物番号 E-1 の合成法に記載の手順に従って、中間体 35 (1.23 g)、臭素 (340  $\mu$ l) および NBS (1.19 g) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 36; 1.42 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 2 時間半行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=1:2) にて行った。

【0441】

3-[5-ブロモ-6-[(S)-1-フェニルエチルオキシ]ピリジン-3-イル] プロピオン酸エチル (化合物番号 E-7) の合成  
化合物番号 A-6 の合成法に記載の手順に従って、中間体 36 (137 mg)、 $\text{Ph}_3\text{P}$  (273 mg)、(R)-1-フェニルエタノール (150  $\mu$ l、TCI)、および 40% DIAD (400  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 E-7; 167 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 11 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=4:1) にて行った。

【0442】

【実施例 E-13】

3-(5-ブロモ-6-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピリジン-3-イル) プロピオン酸エチル (化合物番号 E-13) の合成  
中間体 36 (71.5 mg) のクロロホルム (7 ml) 溶液に、4-トリフルオロメチルベンジルプロマイド (109.2 mg、TCI) および炭酸銀 (120 mg、WAKO) を加え遮光下、室温にて 11 時間攪拌した。反応混合液を濾過し、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号 E-13; 114 mg) を得た。

【0443】

【実施例 E-1~16】

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-E-1 に示す。

【0444】

【表 9】

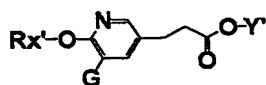


Table-E-1

Exp.	Rx'O	Y'	G	Syn	LCMS		
					method	RTime	Mass
E-1	cPenMeO	Et	Br	E-1	A	5.98	356(M <sup>+</sup> )
E-2	cHexMeO	Et	Br	E-1			
E-3	iBuO	Et	Br	E-1	A	5.57	N.D
E-4	2EtBuO	Et	Br	E-1			
E-5	cPenO	Et	Br	E-1	A	5.62	342 (M <sup>+</sup> )
E-6	cHexO	Et	Br	E-1			
E-7	(R)1PhEtO	Et	Br	E-7	A	5.60	N.D
E-8	2(4DMAPh)EtO	Et	Br	E-7			
E-9	2(2FPh)EtO	Et	Br	E-7			
E-10	2(3FPh)EtO	Et	Br	E-7			
E-11	2(4ClPh)EtO	Et	Br	E-7			
E-12	2(PhO)EtO	Et	Br	E-7			
E-13	4CF <sub>3</sub> BnO	Et	Br	E-13	A	5.78	432 (M <sup>+</sup> )
E-14	2MeBnO	Et	Br	E-13			
E-15	2ClBnO	Et	Br	E-13			
E-16	1(4FPh)EtO	Et	Br	E-7			

## 【実施例 F-1】

4-(3-ブロモ-4-メトキシフェニル)酪酸(中間体37)の合成

化合物番号A-1の合成法に記載の手順に従って4-(4-メトキシフェニル)酪酸(11.64g、A1d)およびNBS(11.21g)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体37; 16.30g)を得た。ただし反応は氷冷下にて30分間、室温にて20時間行った。

## 【0445】

4-(3-ブロモ-4-ヒドロキシフェニル)酪酸メチル(中間体38)の合成

中間体4の合成法に記載の手順に従って中間体37(12.51g)および1M三臭化ホウ素/塩化メチレン溶液(100ml)を反応させ処理することにより得られた残渣を中間体1の合成法に記載の手順に従って塩化チオニル(8.4ml)をメタノール中反応させ処理することにより標記化合物(中間体38; 10.48g)を得た。

## 【0446】

4-(3-ブロモ-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル)酪酸メチル(化合物番号F-1)の合成

化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従って中間体38(2.72g)、Ph<sub>3</sub>P(7.86g)、シクロペンタンメタノール(3.24ml)、および40%DIAD(14.2ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号F-1; 3.33g)を得た。ただし精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:イソプロピルアルコール=10:1)にて行った。

## 【0447】

## 【実施例 F-1~4】

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable-F-1に示す。

## 【0448】

【表 10】

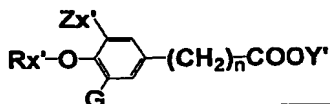


Table-F-1

Exp.	Rx'O	Y'	Zx'	G	n	Syn	LCMS		
							method	RTime	Mass
F-1	cPenMeO	Me	H	Br	3	F-1	C		354(M <sup>+</sup> )
F-2	cPenO	Me	H	Br	3	F-1			
F-3	cHexO	Me	H	Br	3	F-1	C		354(M <sup>+</sup> )
F-4	1(4FPh)EtO	Me	H	Br	3	F-1			

## 〔実施例 G-1〕

3-〔4-メトキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸メチル (中間体 39) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って中間体 20 (460 mg)、2-ナフタレンボロン酸 (886 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液 (1.6 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (298 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 39; 580 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 2 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: イソプロピルエーテル = 8:1) にて行った。

## 【0449】

3-〔4-メトキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸 (中間体 40) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って中間体 39 (773 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (2.3 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 40; 674 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

## 【0450】

3-〔4-ヒドロキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸メチル (中間体 41) の合成

中間体 10 の合成法に記載の手順に従ってピリジンおよび濃塩酸 (各 5 ml) および中間体 40 (551 mg) を反応させ処理することにより粗粉末物質を得た。これを中間体 1 の合成法に記載の手順に従って塩化チオニル (282 μl) とメタノール中反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 41; 531 mg) を得た。

## 【0451】

3-〔4-シクロペンチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸メチル (化合物番号 G-1) の合成

化合物番号 A-6 の合成法に記載の手順に従って中間体 41 (100 mg)、Ph<sub>3</sub>P (262 mg)、シクロペンタノール (91 μl、TCI) および 40% DIAD (473 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 G-1; 120 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 15 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: イソプロピルエーテル = 6:1) にて行った。

## 【0452】

## 〔実施例 G-2〕

3-〔4-シクロペンチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸 (化合物番号 G-2) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 G-1 (115 mg)、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.75 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 G-2; 108 mg) を得た。ただし反応は 4 時間行った。

## 【0453】

## 〔実施例 G-3〕

3-〔4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インドール-5-イル)フェニル〕プロ



## ピオン酸メチル (化合物番号 G-3) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 A-5 (833 mg)、5-インドールボロン酸 (657 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (2.4 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (233 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 G-3; 900 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は3時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) にて行った。

## 【0454】

## 〔実施例 G-4〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 G-4) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 G-3 (144 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (420 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 G-4; 127 mg) を得た。ただし反応は2時間行った。

## 【0455】

## 〔実施例 G-9〕

3-[4-ベンジルオキシ-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (G-9) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 A-8 (349 mg)、1-メチル-1H-インダゾール-5-ボロン酸 (283 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (0.9 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (94.3 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 G-9; 370 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は80℃で6時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル=4:1) にて行った。

## 【0456】

## 〔実施例 G-10〕

3-[4-ベンジルオキシ-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (G-10) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 G-9 (80 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.20 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 G-10; 71 mg) を得た。ただし反応は4時間行った。

## 【0457】

3-[4-ヒドロキシ-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (中間体 42) の合成

化合物番号 G-9 (314 mg) の酢酸エチル (3 ml) / メタノール (3 ml) 混合溶液に 10%パラジウム炭素 (12 mg) を加え、水素雰囲気下室温にて16時間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去して標記化合物 (中間体 48; 288 mg) を得た。

## 【0458】

## 〔実施例 G-23〕

3-(3-プロモ-4-tert-ブチルジメチルシリルオキシフェニル)プロピオン酸メチル (中間体 43) の合成

中間体 16 の合成法に記載の手順に従って中間体 5 (5.18 g)、イミダゾール (2.04 g) および tert-ブチルジメチルシリルクロリド (4.52 g) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 43; 8.42 g) を得た。ただし反応は16時間行った。

## 【0459】

3-[4-(tert-ブチルジメチルシリルオキシ-3-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (中間体 44) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って、5-インドールボロン酸 (4.83 g)、中間体 34 (7.46 g)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (18 ml)、(Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (1.62 g) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 44; 5.04 g)

)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は12.5時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=9:1)にて行った。

【0460】

3-[4-ヒドロキシ-3-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(中間体45)の合成

中間体19の合成法に記載の手順に従って中間体35(5.04g)、酢酸(2.8ml)およびテトラブチルアンモニウムフルオリド/THF 1M溶液(49ml、TCI)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体45; 3.13g)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて行った。

【0461】

3-[3-(1H-インドール-5-イル)-4-(4-メチルフェニルメチルオキシ)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号G-23)の合成

化合物番号A-2の合成法に記載の手順に従って中間体45(80mg)、炭酸カリウム(114mg)および4-メチルベンジルブロミド(54 $\mu$ l、TCI)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号G-23; 104mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は15時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

【0462】

【実施例G-24】

3-[3-(1H-インドール-5-イル)-4-(4-メチルフェニルメチルオキシ)フェニル]プロピオン酸(化合物番号G-24)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号G-23(99mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(500 $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号G-24; 84mg)を得た。ただし反応は3時間行った。

【0463】

【実施例G-106】

N-[2-(t-ブチルジフェニルシリルオキシ)エチル]アニリン(中間体46)の合成

2-アニリノエタノール(5.82g、TCI)の無水DMF(50ml)溶液にイミダゾール(3.23g、TCI)を加え、t-ブチルジフェニルシリルクロリド(12.48g、TCI)のDMF(50ml)溶液を氷冷下滴下し30分攪拌した後、室温に昇温しさらに3時間半攪拌した。反応混合液に水(100ml)を加え酢酸エチル(100ml)で抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=9:1)で精製し、標記化合物(中間体46; 15.61g)を得た。

【0464】

N-ベンジル-N-[2-(t-ブチルジフェニルシリルオキシ)エチル]アニリン(中間体47)の合成

化合物番号A-2の合成法に記載の手順に従って中間体46(15.60g)、炭酸カリウム(8.91g)およびベンジルブロミド(6.05ml、TCI)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体47; 19.23g)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は15時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

【0465】

2-(N-ベンジル-N-フェニルアミノ)エタノール(中間体48)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って、中間体47(19.22g)およびテトラブチルアンモニウムフルオリド/THF 1M溶液(86ml)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体48; 9.06g)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は1時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=5:1

)にて行った。

【0466】

3- {4-[2-(N-ベンジル-N-フェニルアミノ)エチルオキシ]-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル}プロピオン酸メチル(化合物番号G-106)の合成  
化合物番号A-6の合成法に記載の手順に従って中間体41(1.26g)、Ph<sub>3</sub>P(1.34g)、中間体48(1.01g)および40%DIADのかわりにDBAB(1.18g)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号G-106; 1.39g)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は15時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=7:1)にて行った。

【0467】

〔実施例G-107〕

3- {3-(ナフタレン-2-イル)-4-[2-(N-フェニルアミノ)エチルオキシ]フェニル}プロピオン酸メチル(化合物番号G-107)の合成  
化合物番号G-106(1.39g)のTHF(10ml)/メタノール(20ml)混合溶液に濃塩酸(75ul、WAKO)及び10%パラジウム炭素(142mg)を加え、水素ガス雰囲気下室温にて3時間攪拌した。反応混合液を濾過し濾液の溶媒を減圧下留去し、標記化合物(化合物番号G-107; 842mg)を得た。

【0468】

〔実施例G-108〕

3- {3-(ナフタレン-2-イル)-4-[2-(フェニルアミノ)エチルオキシ]フェニル}プロピオン酸(化合物番号G-108)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号G-107(46mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(0.25ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号G-108; 41mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

【0469】

〔実施例G-1~121〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable-G-1~4に示す。

【0470】

【表 11】

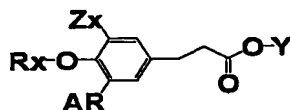








Table-G-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
G-1	cPenMeO	Me	H	2-Nap	G-1	C		388(M <sup>+</sup> )
G-2	cPenMeO	H	H	2-Nap	G-2	C		375 (M <sup>+</sup> +1)
G-3	cPenMeO	Me	H	5-Ind	G-3			
G-4	cPenMeO	H	H	5-Ind	G-4	C		363 (M <sup>+</sup> )
G-5	cPenMeO	Me	H	1Me-5-Ind	G-3			
G-6	cPenMeO	H	H	1Me-5-Ind	G-4	A		391 (M <sup>+</sup> +1)
G-7	cPenMeO	Me	H	5-1HIdz	G-3			
G-8	cPenMeO	H	H	5-1HIdz	G-4			
G-9	BnO	Me	H	1Me-5-1HIdz	G-9			
G-10	BnO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-10			
G-11	cPenMeO	Me	H	1Me-5-1HIdz	G-3			
G-12	cPenMeO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-4			
G-13	2EtBuO	H	H	2-Nap	G-1,G-2	A		377 (M <sup>+</sup> +1)
G-14	2EtBuO	H	H	5-Ind	G-3,G-4			
G-15	4Me,cHexO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-16	4Me,cHexO	H	H	5-Ind	G-3,G-4	D	5.46	378 (M <sup>+</sup> +1)
G-17		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-18		H	H	5-Ind	G-3,G-4			
G-19	cHepO	H	H	5-Ind	G-3,G-4			
G-20	3PhPrO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-21	4PhBuO	H	H	5-Ind	G-3,G-4			
G-22		H	H	2-Nap	G-1,G-2	D	5.40	414 (M <sup>+</sup> +1)
G-23	4MeBnO	Me	H	5-Ind	G-23			
G-24	4MeBnO	H	H	5-Ind	G-24			
G-25	2(4MePh)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-26	2(4MePh)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-27	4ClBnO	H	H	2-Nap	G-23,G-24			
G-28	4CF <sub>3</sub> BnO	H	H	5-Ind	G-23,G-24			
G-29	3F,4(OMe)BnO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-30	3F,4(OMe)BnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-31		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-32		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-33		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-34		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-35		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-36		H	H	5-Ind	G-1,G-2			

【0471】

【表 12】

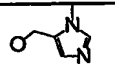
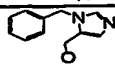
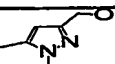
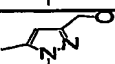
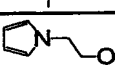
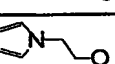
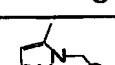
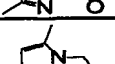
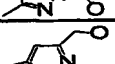
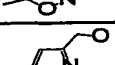
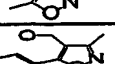
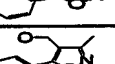
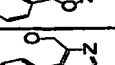

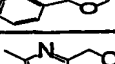
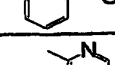
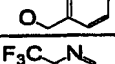
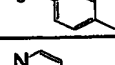
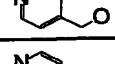
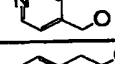
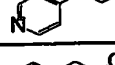
Table-G-2

G-37	1IndanO	H	H	5-Ind	G-1,G-2	D	5.19	398 (M <sup>+</sup> +1)
G-38	2IndanO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-39	2IndanO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-40	5OMe-2-IndanO	H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		439(M <sup>+</sup> +1)
G-41	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	H	5-Ind	G-1,G-2	C		458(M <sup>+</sup> +1)
G-42	5F-2-IndanO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-43	5F-2-IndanO	H	H	5-Ind	G-1,G-2	C		416(M <sup>+</sup> +1)
G-44		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-45		H	H	5-Ind	G-1,G-2	A	5.46	412 (M <sup>+</sup> +1)
G-46		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-47		H	H	5-1HInd	G-1,G-2			
G-48	2(2MePh)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-49	2(2MePh)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-50	2(3FPh)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-51	2(2ClPh)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-52	2(3ClPh)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-53	2(2CF <sub>3</sub> Ph)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-54	4(CF <sub>3</sub> Ph)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-55	2(2OMePh)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		427 (M <sup>+</sup> +1)
G-56	2(4OMePh)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-57	2(1-NapEt)O	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-58	2(2-Nap)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-59	2(2-Nap)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2	C		435 (M <sup>+</sup> )
G-60	2(4ClPh)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-61		H	H	5-Ind	G-1,G-2	D	5.11	430 (M <sup>+</sup> +1)
G-62		H	H	1Me-5-1HIdz	G-1,G-2			
G-63	2(PhS)EtO	H	H	2-Nap	G-1,G-2	A		402 (M <sup>+</sup> +1)
G-64	2(PhS)EtO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-65	3PhPrO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-66	2ClBnO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-67	2BrBnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2	C		450 (M <sup>+</sup> )
G-68	3,5DMeBnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-69	4tBuBnO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-70	2CF <sub>3</sub> BnO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-71	4CF <sub>3</sub> BnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-72	4nBuBnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-73	3,5DClBnO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-74	2,3DClBnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-75	2PhBnO	H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-76	4PhBnO	H	H	5-Ind	G-1,G-2	A		448 (M <sup>+</sup> +1)

【0472】

【表 13】

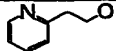
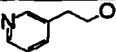
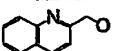
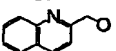
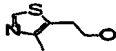
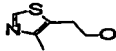
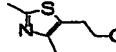
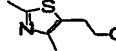
Table-G-3

G-77		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-78		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-79		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-80		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-81		H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		386 (M <sup>+</sup> +1)
G-82		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-83		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-84		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-85		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-86		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-87		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-88		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-89		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-90		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-91		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-92		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-93		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-94		H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		384 (M <sup>+</sup> +1)
G-95		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-96		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-97		H	H	5-Ind	G-1,G-2			

【0473】

【表 14】

Table-G-4

G-98		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-99		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-100		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-101		H	H	5-Ind	G-1,G-2	C		423 (M <sup>+</sup> +1)
G-102		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-103		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-104		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
G-105		H	H	5-Ind	G-1,G-2			
G-106	2(Ph,BnN)EtO	Me	H	2-Nap	G-106			
G-107	2(PhNH)EtO	Me	H	2-Nap	G-107			
G-108	2(PhNH)EtO	H	H	2-Nap	G-108	C		412(M <sup>+</sup> +1)
G-109	2(PhNH)EtO	Me	H	5-Ind	G-107			
G-110	2(PhNH)EtO	H	H	5-Ind	G-108			
G-111	2(PhNH)EtO	Me	H	1Me-5-Ind	G-107			
G-112	2(PhNH)EtO	H	H	1Me-5-Ind	G-108	C		415(M <sup>+</sup> +1)
G-113	2(PhNH)EtO	Me	H	5-1HIdz	G-107			
G-114	2(PhNH)EtO	H	H	5-1HIdz	G-108			
G-115	2(PhNH)EtO	Me	H	1Me-5-1HIdz	G-107	A	4.76	430(M <sup>+</sup> +1)
G-116	2(PhNH)EtO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-108	C		416(M <sup>+</sup> +1)
G-117	iBuO	H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		352(M <sup>+</sup> +1)
G-118	iBuO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-1,G-2	C		353(M <sup>+</sup> +1)
G-119	PhO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-3,G-4	A	4.10	373(M <sup>+</sup> +1)
G-120	4ClPhO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-3,G-4	A	4.46	407(M <sup>+</sup> +1)
G-121	4MeOPhO	H	H	1Me-5-1HIdz	G-3,G-4	A	4.12	403(M <sup>+</sup> +1)

## 【実施例 H-1~32】

本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-H-1~2 に示す。

【0474】

【表 15】

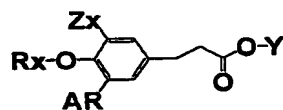


Table-H-1















Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
H-1		Me	H	2-Nap	G-1			
H-2		H	H	2-Nap	G-2			
H-3		Me	H	5-Ind	G-1	C		375 (M <sup>+</sup> +1)
H-4		H	H	5-Ind	G-2			
H-5		Me	H	1Me-5-Ind	G-1			
H-6		H	H	1Me-5-Ind	G-2			
H-7		Me	H	5-1Hldz	G-1			
H-8		H	H	5-1Hldz	G-2			
H-9		Me	H	1Me-5-1Hldz	G-1			
H-10		H	H	1Me-5-1Hldz	G-2	C		454 (M <sup>+</sup> +1)
H-11		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-12		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		452 (M <sup>+</sup> +1)
H-13		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-14		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
H-15		H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		464 (M <sup>+</sup> +1)
H-16		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
H-17		H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		450 (M <sup>+</sup> +1)
H-18		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

【0475】



【表 16】

Table-H-2

H-19		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-20		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
H-21		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-22		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		471 (M <sup>+</sup> +1)
H-23		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-24		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
H-25		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-26		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
H-27		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-28		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		460 (M <sup>+</sup> +1)
H-29		H	H	2-Nap	G-1,G-2			
H-30		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
H-31		H	H	2-Nap	G-1,G-2	C		452 (M <sup>+</sup> +1)
H-32		H	H	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

## 【実施例 J-1】

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-フルオロ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号J-1)の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号A-21(154mg)、5-インドールボロン酸(100mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(1.5ml)および(PH<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(50mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号J-1; 125mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は13時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて行った。

【0476】

## 【実施例 J-2】

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-フルオロ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号J-2)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号J-1(124mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(630μl)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号J-2; 97mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

【0477】

## 【実施例 J-3】

3-[3-クロロ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号J-3)の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号A-20(151mg)、5-インドールボロン酸(97mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(1.5ml)および(PH<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(46mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号J-3; 160mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は13時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて行った。

【0478】

〔実施例 J-4〕

3-[3-クロロ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号 J-4)の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 J-3 (135 mg)、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (660  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 J-4; 97 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

【0479】

〔実施例 J-1~92〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-J-1~3 に示す。

【0480】

【表 17】

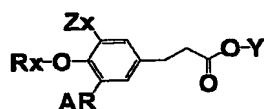






Table-J-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
J-1	cPenMeO	Me	F	5-Ind	J-1	A		396 ( $M^{+}+1$ )
J-2	cPenMeO	H	F	5-Ind	J-2			
J-3	cPenMeO	Me	Cl	5-Ind	J-3			
J-4	cPenMeO	H	Cl	5-Ind	J-4	C		398 ( $M^{+}+1$ )
J-5	cPenMeO	Me	F	2-Nap	J-1			
J-6	cPenMeO	H	F	2-Nap	J-2			
J-7	cPenMeO	Me	F	1Me-5-Ind	J-1			
J-8	cPenMeO	H	F	1Me-5-Ind	J-2			
J-9	cPenMeO	Me	F	5-1Hidz	J-1			
J-10	cPenMeO	H	F	5-1Hidz	J-2			
J-11	cPenMeO	Me	F	1Me-5-1Hidz	J-1			
J-12	cPenMeO	H	F	1Me-5-1Hidz	J-2	C		397 ( $M^{+}+1$ )
J-13	2EtBuO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-14	2EtBuO	H	F	5-Ind	G-1,G-2			
J-15	4Me,cHexO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-16	4Me,cHexO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-17		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-18		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		452 ( $M^{+}+1$ )
J-19	cHepO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-20	3PhPrO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-21	4PhBuO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-22		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-23	1(4MePh)EtO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-24	4ClBnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-25	4CF3BnO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-26	3F,4(OMe)BnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-27		H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		429 ( $M^{+}+1$ )
J-28		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-29		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-30		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-31		H	F	2-Nap	G-1,G-2			

【0481】

【表18】

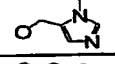
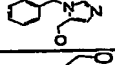

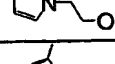
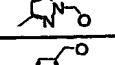
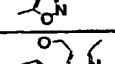
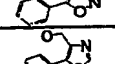
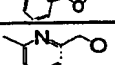
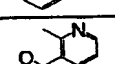
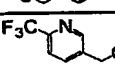
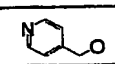
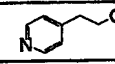
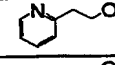
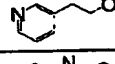
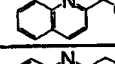
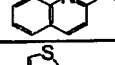
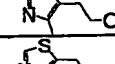

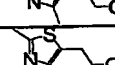

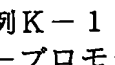
Table-J-2

J-32	1-IndanO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-33	2-IndaneO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-34	2-IndaneO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-35	5OMe-2-IndanO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-36	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-37	5F-2-IndanO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-38	5F-2-IndanO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-39		H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		441 (M <sup>+</sup> +1)
J-40		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-41	2(3MePh)EtO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-42	2(4MePh)EtO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-43	2(2ClPh)EtO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-44	2(3ClPh)EtO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-45	2(2CF <sub>3</sub> Ph)EtO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-46	2(2OMePh)EtO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-47	2(4OMePh)EtO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-48	2(2-Nap)EtO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-49		H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		458 (M <sup>+</sup> +1)
J-50		H	F	1Me-5-1HIdz	G-1,G-2			
J-51	2(PhS)EtO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-52	3PhPrO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-53	2ClBnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-54	2BrBnO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-55	3,5DMeBnO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-56	4tBuBnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		460 (M <sup>+</sup> +1)
J-57	2CF <sub>3</sub> BnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-58	4CF <sub>3</sub> BnO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-59	4nBuOBnO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-60	3,5DClBnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-61	2,3DClBnO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-62	2-NapMeO	H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		451 (M <sup>+</sup> +1)
J-63	1-NapMeO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-64	2PhBnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-65	4PhBnO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-66	5OMe-2-IndanO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-67	5OMe-2-IndanO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-68	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-69	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-70	5F-2-IndanO	H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-71	5F-2-IndanO	H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

【0482】

【表 19】

Table-J-3

J-72		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-73		H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		481 (M <sup>+</sup> +1)
J-74		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-75		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-76		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-77		H	F	1Me-5-1HIndz	G-1,G-2	C		410 (M <sup>+</sup> +1)
J-78		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-79		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-80		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-81		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-82		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-83		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-84		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-85		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		419 (M <sup>+</sup> +1)
J-86		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-87		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-88		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-89		H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		436 (M <sup>+</sup> +1)
J-90		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
J-91		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
J-92		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

## 〔実施例 K-11〕

3-[3-プロモ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号K-11)の合成  
 化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号B-117(306mg)、2-ナフタレンボロン酸(163mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(689μl)および(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>Pd(74.2mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号K-11; 261mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は15時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=9:1)にて行った。

## 【0483】

3-[3-プロモ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号K-12)の合成  
 中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号K-11(131mg)、2規定水酸

化ナトリウム水溶液 ( $400\mu\text{l}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 K-12;  $109\text{mg}$ ) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

## 【0484】

## 〔実施例 K-13〕

3-[3-プロモ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 K-13) の合成  
化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 B-117 ( $102\text{mg}$ )、5-インドールボロン酸 ( $97\text{mg}$ )、2M 炭酸ナトリウム水溶液 ( $1.5\text{ml}$ ) および  $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  ( $46\text{mg}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 K-13;  $85\text{mg}$ ) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 13 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1) にて行った。

## 【0485】

## 〔実施例 K-14〕

3-[3-プロモ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 K-14) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 K-13 ( $85\text{mg}$ )、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 ( $200\mu\text{l}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 K-14;  $79\text{mg}$ ) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

## 【0486】

## 〔実施例 K-17〕

3-[3-プロモ-4-シクロペンチルオキシ-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 K-17) の合成  
化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 B-118 ( $306\text{mg}$ )、1-メチル-1H-インダゾール-5-ボロン酸 ( $175\text{mg}$ )、2M 炭酸ナトリウム水溶液 ( $0.68\text{ml}$ ) および  $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  ( $70.1\text{mg}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 K-17;  $148\text{mg}$ ) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は  $80^\circ\text{C}$  で 14 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=4:1) にて行った。

## 【0487】

## 〔実施例 K-1~40〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table K-1~2 に示す。

## 【0488】

【表 20】

Table-K-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
K-1		Me	F	2-Nap	G-1			
K-2		H	F	2-Nap	G-2			
K-3		Me	F	5-Ind	G-1			
K-4		H	F	5-Ind	G-2	C		457(M <sup>+</sup> +1)
K-5		Me	F	1Me-5-Ind	G-1			
K-6		H	F	1Me-5-Ind	G-2	C		471(M <sup>+</sup> +1)
K-7		Me	F	5-1HIdz	G-1			
K-8		H	F	5-1HIdz	G-2			
K-9		Me	F	1Me-5-1HIdz	G-1			
K-10		H	F	1Me-5-1HIdz	G-2			
K-11	cPenMeO	Me	Br	2-Nap	K-11			
K-12	cPenMeO	H	Br	2-Nap	K-12			
K-13	cPenMeO	Me	Br	2-Nap	K-13			
K-14	cPenMeO	H	Br	5-Ind	Int50,K-13	C		456(M <sup>+</sup> )
K-15	cPenO	H	Br	2-Nap	K-11,K-12			
K-16	cPenO	H	Br	1Me-5-Ind	K-11,K-12			
K-17	cPenO	Me	Br	1Me-5-1HIdz	K-11,K-12			
K-18	cPenO	H	Br	1Me-5-1HIdz	K-11,K-12	A	4.78	443(M <sup>+</sup> )
K-19		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-20		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-21		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-22		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-23		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-24		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		485(M <sup>+</sup> +1)
K-25		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-26		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

【0489】

【表 21】

Table-K-2

K-27		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-28		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-29		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-30		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-31		H	F	2-Nap	G-1,G-2	C		486(M <sup>+</sup> +1)
K-32		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-33		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-34		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		511(M <sup>+</sup> +1)
K-35		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-36		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-37		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-38		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
K-39		H	F	2-Nap	G-1,G-2			
K-40		H	F	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

## 【実施例 L-1】

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-メチル-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号L-1)の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従ってA-24(63mg)、2-ナフタレンボロン酸(67mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(130 $\mu$ l)および(Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(18mg)を反応させ処理した。ただし以下の変更を加えた。反応は80℃で6時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=20:1)にて行った。ここで得られた物質を中間体9の合成法に記載の手順に従って2規定水酸化ナトリウム水溶液(200 $\mu$ l)と反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号L-1; 25mg)を得た。

【0490】

## 【実施例 L-2】

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-メチル-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号L-2)の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号K-17(115mg)、メチルボロン酸(66mg、Ald)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0.40ml)および(Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(39.4mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体52; 84mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は80℃で12時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=4:1)にて行った。

【0491】

## 【実施例 L-3】

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-メチル-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号L-3)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号L-2(82mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(0.26ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号

L-3; 62 mg) を得た。ただし反応は 1 時間半行った。

【0492】

【実施例 L-1 ~ 95】

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-L-1 ~ 3 に示す。

【0493】

【表 22】

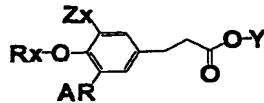


Table-L-1

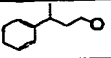
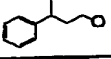
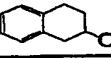

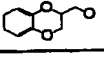
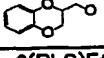
Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
L-1	cPenO	H	Me	2-Nap	L-1	A	5.65	375(M <sup>+</sup> +1)
L-2	cPenO	Me	Me	1Me-5-1Hdz	L-2			
L-3	cPenO	H	Me	1Me-5-1Hdz	L-3	A	4.50	379(M <sup>+</sup> +1)
L-4	2EtBuO	Me	Me	2-Nap	L-2			
L-5	2EtBuO	H	Me	2-Nap	L-3	C		391(M <sup>+</sup> +1)
L-6	2EtBuO	H	Me	6-OMe-2-Nap	L-2, L-3			
L-7	2EtBuO	Me	Me	5-Ind	L-2			
L-8	2EtBuO	H	Me	5-Ind	L-3			
L-9	2EtBuO	Me	Me	1Me-5-Ind	L-2			
L-10	2EtBuO	H	Me	1Me-5-Ind	L-3			
L-11	2EtBuO	Me	Me	5-1Hdz	L-2			
L-12	2EtBuO	H	Me	5-1Hdz	L-3			
L-13	2EtBuO	Me	Me	1Me-5-1Hdz	L-2			
L-14	2EtBuO	H	Me	1Me-5-1Hdz	L-3	C		395(M <sup>+</sup> +1)
L-15	2EtBuO	Me	Me	5-Bzt	L-2			
L-16	2EtBuO	H	Me	5-Bzt	L-3			
L-17	2EtBuO	Me	Me	5-2ABzt	L-2			
L-18	2EtBuO	H	Me	5-2ABzt	L-3			
L-19	2EtBuO	Me	Me	2Me-5-Bzt	L-2			
L-20	2EtBuO	H	Me	2Me-5-Bzt	L-3			
L-21	4Me,cHexO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2			
L-22		H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-23	cHepO	H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-24	cHepO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2	C		406(M <sup>+</sup> +1)
L-25	3PhPrO	H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-26	4PhBuO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2			
L-27		H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-28	1(4MePh)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2	C		428(M <sup>+</sup> +1)
L-29	4ClBnO	H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-30	4CF <sub>3</sub> BnO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2			
L-31	3F,4(OMe)BnO	H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-32		H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2			
L-33		H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-34		H	Me	2-Nap	G-1, G-2			
L-35		H	Me	1Me-5-Ind	G-1, G-2			

【0494】



【表 23】

Table-L-2

L-36		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-37		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-38	1-IndanO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-39	2-IndanO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		423(M <sup>+</sup> +1)
L-40	2-IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-41	5OMe-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-42	5,6D(OMe)-2-IndanO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-43	5F-2-IndaneO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-44	5F-2-IndaneO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-45		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-46		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-47	2(3MePh)EtO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-48	2(3FPh)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		432(M <sup>+</sup> +1)
L-49	2(2ClPh)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-50	2(4CF <sub>3</sub> Ph)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-51	2(2OMePh)EtO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		441(M <sup>+</sup> +1)
L-52	2(4OMePh)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-53	2(2-Nap)EtO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-54	2(2-Nap)EtO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-55		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-56		H	Me	1Me-5-1Hdz	G-1,G-2	C		459(M <sup>+</sup> +1)
L-57	2(PhS)EtO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-58	3PhPrO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-59	2ClBnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-60	2BrBnO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-61	3,5DMeBnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-62	4tBuBnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-63	2CF <sub>3</sub> BnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-64	4tBuBnO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-65	4nBuBnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		453(M <sup>+</sup> +1)
L-66	3,5DCIBnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-67	2,3DCIBnO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-68	2-NapMeO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-69	1-NapMeO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-70	2PhBnO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-71	4PhBnO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		476(M <sup>+</sup> +1)
L-72	5OMe-2-IndanO	H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-73	5F-2-IndaneO	H	Me	2-Nap	G-1,G-2			

【0495】

【表 2 4】

Table-L-3

L-74		H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		401(M <sup>+</sup> +1)
L-75		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-76		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-77		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-78		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-79		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-80		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-81		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-82		H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		412(M <sup>+</sup> +1)
L-83		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-84		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-85		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-86		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-87		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-88		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-89		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		415(M <sup>+</sup> +1)
L-90		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-91		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
L-92		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-93		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		435(M <sup>+</sup> +1)
L-94		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
L-95		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

## 〔実施例M-1～32〕

本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable-M-1～2に示す。

【0496】

【表 25】

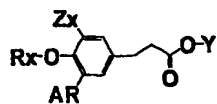


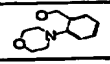
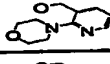
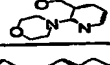
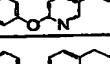
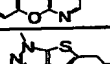
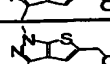

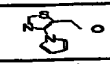
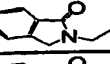
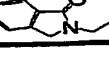
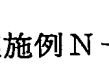
Table-M-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
M-1		Me	Me	2-Nap	G-1	C		478(M <sup>+</sup> +1)
M-2		H	Me	2-Nap	G-2	C		464(M <sup>+</sup> +1)
M-3		Me	Me	5-Ind	G-1			
M-4		H	Me	5-Ind	G-2			
M-5		Me	Me	1Me-5-Ind	G-1			
M-6		H	Me	1Me-5-Ind	G-2	C		467(M <sup>+</sup> +1)
M-7		Me	Me	5-1HIdz	G-1			
M-8		H	Me	5-1HIdz	G-2			
M-9		Me	Me	1Me-5-1HIdz	G-1			
M-10		H	Me	1Me-5-1HIdz	G-2			
M-11		H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		463(M <sup>+</sup> +1)
M-12		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-13		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-14		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		465(M <sup>+</sup> +1)
M-15		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-16		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-17		H	Me	2-Nap	G-1,G-2	C		464(M <sup>+</sup> +1)
M-18		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-19		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-20		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-21		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			

【0497】

【表 26】

Table-M-2

M-22		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-23		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-24		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		486(M <sup>+</sup> +1)
M-25		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-26		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-27		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-28		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			
M-29		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-30		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2	C		472(M <sup>+</sup> +1)
M-31		H	Me	2-Nap	G-1,G-2			
M-32		H	Me	1Me-5-Ind	G-1,G-2			

## 【実施例 N-1】

3- {4-[2-(N-アセチル-N-フェニルアミノ) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸メチル (化合物番号 N-1) の合成  
 化合物番号 G-107 (32 mg) の塩化メチレン (1 ml) 溶液に、ピリジン (24  $\mu$ l、TCI) 及びアセチルクロライド (21  $\mu$ l、TCI) を加え 17 時間攪拌した。反応混合液に水 (3 ml) を加え塩化メチレン (10 ml) で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン：酢酸エチル=2:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号 N-1; 28.1 mg) を得た。

## 【0498】

## 【実施例 N-2】

3- {4-[2-(N-アセチル-N-フェニルアミノ) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸 (化合物番号 N-2) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 N-1 (28 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.25 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 N-2; 22 mg) を得た。ただし反応は 3 時間行った。

## 【0499】

## 【実施例 N-29】

3- {4-[2-(N-メトキシカルボニル-N-フェニルアミノ) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸メチル (化合物番号 N-29) の合成  
 化合物番号 N-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 G-107 (32 mg)、ピリジン (24  $\mu$ l) およびクロロ蟻酸メチル (23  $\mu$ l、TCI) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 N-29; 17.3 mg) を得た。

## 【0500】

## 【実施例 N-30】

3- {4-[2-(N-メトキシカルボニル-N-フェニルアミノ) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸 (化合物番号 N-30) の合成  
 中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 N-29 (17 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.25 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 N-30; 10.1 mg) を得た。ただし反応は 3 時間行った。

## 【0501】

## 〔実施例N-48〕

3- {4-[2-(N-メチルスルホニル-N-フェニルアミノ) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸メチル (化合物番号N-48) の合成  
化合物番号N-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号G-107 (32mg)、ピリジン (24ul) およびメタンスルホニルクロライド (23ul) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号N-48; 32.3mg) を得た。

## 【0502】

## 〔実施例N-49〕

3- {4-[2-(N-メチルスルホニル-N-フェニルアミノ) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸 (化合物番号N-49) の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号N-48 (32mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.25ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号N-49; 17mg) を得た。ただし反応は3時間行った。

## 【0503】

## 〔実施例N-55〕

3- {4-[2-(3-エチル-1-フェニルウレイド) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸メチル (化合物番号N-55) の合成  
化合物番号N-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号G-107 (32mg)、ピリジン (24ul) およびエチルイソシアネート (24ul、ナカライテクス社製) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号N-55; 31.2mg) を得た。ただし反応は41時間行った。

## 【0504】

## 〔実施例N-56〕

3- {4-[2-(3-エチル-1-フェニルウレイド) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸 (化合物番号N-56) の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号N-55 (31mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.25ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号N-56; 15mg) を得た。ただし反応は3時間行った。

## 【0505】

## 〔実施例N-64〕

3- {4-[2-(3-エチル-1-フェニルチオウレイド) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸メチル (化合物番号N-64) の合成  
化合物番号N-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号G-107 (32mg)、ピリジン (24ul) およびエチルイソチオシアネート (21ul、ナカライテクス社製) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号N-64; 27.4mg) を得た。ただし反応は41時間行った。

## 【0506】

## 〔実施例N-65〕

3- {4-[2-(3-エチル-1-フェニルチオウレイド) エチルオキシ]}-3-(ナフタレン-2-イル) フェニル} プロピオン酸 (化合物番号N-65) の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号N-64 (27mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.25ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号N-65; 8.9mg) を得た。ただし反応は3時間行った。

## 【0507】

## 〔実施例N-1~74〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable-N-1~2に示す。

## 【0508】

【表 27】

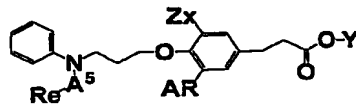


Table-N-1

Exp.	A <sup>5</sup> Re	Y	Zx	AR	Syn	LGMS		
						method	RTime	Mass
N-1	COMe	Me	H	2-Nap	N-1			
N-2	COMe	H	H	2-Nap	N-2			
N-3	COMe	Me	H	5-Ind	N-1			
N-4	COMe	H	H	5-Ind	N-2	C		457(M <sup>+</sup> +1)
N-5	COMe	Me	H	1Me-5-Ind	N-1			
N-6	COMe	H	H	1Me-5-Ind	N-2			
N-7	COMe	Me	H	5-1Hdz	N-1			
N-8	COMe	H	H	5-1Hdz	N-2			
N-9	COMe	Me	H	1Me-5-1Hdz	N-1			
N-10	COMe	H	H	1Me-5-1Hdz	N-2			
N-11	COPh	H	H	2-Nap	N-1,N-2	C		516(M <sup>+</sup> +1)
N-12	COPh	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-13	COtBu	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-14	COtBu	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-15	COiPr	H	H	2-Nap	N-1,N-2	C		496(M <sup>+</sup> +1)
N-16	COiPr	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-17	COCH(Et) <sub>n</sub> Bu	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-18	COCH(Et) <sub>n</sub> Bu	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-19	COCH <sub>2</sub> OMe	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-20	COCH <sub>2</sub> OMe	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-21	COCH=CHMe	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-22	COCH=CHMe	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2	C		483(M <sup>+</sup> +1)
N-23	COiBu	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-24	COiBu	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-25	COcPr	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-26	COcPr	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2	C		483(M <sup>+</sup> +1)
N-27	CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> cPen	H	H	2-Nap	N-1,N-2			
N-28	CO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> cPen	H	H	1Me-5-Ind	N-1,N-2			
N-29	COOMe	Me	H	2-Nap	N-29			
N-30	COOMe	H	H	2-Nap	N-30			
N-31	COOMe	H	H	1Me-5-Ind	N-29,N-30			
N-32	COOPh	H	H	2-Nap	N-29,N-30	C		516(M <sup>+</sup> +1)
N-33	COOPh	H	H	1Me-5-Ind	N-29,N-30			
N-34	CONMe <sub>2</sub>	H	H	2-Nap	N-29,N-30	C		483(M <sup>+</sup> +1)
N-35	CONMe <sub>2</sub>	H	H	1Me-5-Ind	N-29,N-30			
N-36	COOiBu	H	H	2-Nap	N-29,N-30			
N-37	COOiBu	H	H	1Me-5-Ind	N-29,N-30			
N-38	C(O)SMe	H	H	2-Nap	N-29,N-30			
N-39	C(O)SMe	H	H	1Me-5-Ind	N-29,N-30			
N-40		H	H	2-Nap	N-29,N-30			
N-41		H	H	1Me-5-Ind	N-29,N-30	C		528(M <sup>+</sup> +1)

【0509】

【表 28】

Table-N-2

N-42		H	H	2-Nap	Int53,N-29			
N-43		H	H	1Me-5-Ind	Int53,N-29			
N-44	COO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	H	2-Nap	Int53,N-29			
N-45	COO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	H	1Me-5-Ind	Int53,N-29			
N-46		H	H	2-Nap	Int53,N-29			
N-47		H	H	1Me-5-Ind	Int53,N-29			
N-48	SO <sub>2</sub> Me	Me	H	2-Nap	N-48			
N-49	SO <sub>2</sub> Me	H	H	2-Nap	N-49			
N-50	SO <sub>2</sub> Me	H	H	1Me-5-Ind	N-48,N-49	C		493(M <sup>+</sup> +1)
N-51	SO <sub>2</sub> Ph	H	H	2-Nap	N-48,N-49			
N-52	SO <sub>2</sub> Ph	H	H	1Me-5-Ind	N-48,N-49			
N-53	SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	H	2-Nap	N-48,N-49	C		519(M <sup>+</sup> +1)
N-54	SO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	H	1Me-5-Ind	N-48,N-49			
N-55	CONHEt	Me	H	2-Nap	N-55			
N-56	CONHEt	H	H	2-Nap	N-56	C		483(M <sup>+</sup> +1)
N-57	CONHEt	H	H	1Me-5-Ind	N-55,N-56			
N-58	CONHPh	H	H	2-Nap	N-55,N-56			
N-59	CONHPh	H	H	1Me-5-Ind	N-55,N-56			
N-60	CONHcHex	H	H	2-Nap	N-55,N-56			
N-61	CONHcHex	H	H	1Me-5-Ind	N-55,N-56	C		540(M <sup>+</sup> +1)
N-62	CONHBn	H	H	2-Nap	N-55,N-56			
N-63	CONHBn	H	H	1Me-5-Ind	N-55,N-56			
N-64	CSNHMe	Me	H	2-Nap	N-64			
N-65	CSNHMe	H	H	2-Nap	N-65			
N-66	CSNHMe	H	H	1Me-5-Ind	N-64,N-65			
N-67	CSNHPh	H	H	2-Nap	N-64,N-65			
N-68	CSNHPh	H	H	1Me-5-Ind	N-64,N-65			
N-69	CSNH(3-Py)	H	H	2-Nap	N-64,N-65	C		548(M <sup>+</sup> +1)
N-70	CSNH(3-Py)	H	H	1Me-5-Ind	N-64,N-65			
N-71	CSNHtPr	H	H	2-Nap	N-64,N-65			
N-72	CSNHtPr	H	H	1Me-5-Ind	N-64,N-65	C		516(M <sup>+</sup> +1)
N-73	CSNHBn	H	H	2-Nap	N-64,N-65			
N-74	CSNHBn	H	H	1Me-5-Ind	N-64,N-65			

## 【実施例 P-1】

3-[2-シクロペンチルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)ピリジン-5-イル]プロピオン酸エチル(化合物番号P-1)の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って2-ナフタレンボロン酸(119mg)、化合物番号E-1(83mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0.3ml)および(PH<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(38.1mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号P-1; 76mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は14時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

## 【0510】

## 【実施例 P-2】

3-[2-シクロペンチルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)ピリジン-5-イル]プロピオン酸(化合物番号P-2)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号P-1(47.8mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(0.2ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号P-2; 20mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

## 【0511】

## 【実施例 P-36】

3-[3-(ナフタレン-2-イル)-2-[(R)-1-フェニルエチルオキシ]ピリジン-5-イル]プロピオン酸エチル(化合物番号P-36)の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って、2-ナフタレンボロン酸 (44 mg)、化合物番号 E-7 (73.3 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (120 ul)、 $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  (21.3 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 P-36; 44 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1) にて行った。

**【0512】****〔実施例 P-37〕**

3- {3- (ナフタレン-2-イル) -2- [(R)-1-フェニルエチルオキシ] ピリジン-5-イル} プロピオン酸 (化合物番号 P-37) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 P-36 (41.2 mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.1 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 P-37; 38 mg) を得た。

**【0513】****〔実施例 P-42〕**

3- {3- (ナフタレン-2-イル) -2- [4- (トリフルオロメチル) フェニルメチルオキシ] ピリジン-5-イル} プロピオン酸エチル (化合物番号 P-42) の合成  
化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って、2-ナフタレンボロン酸 (37.4 mg)、化合物番号 E-13 (42.4 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (90 ul) および  $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  (21.4 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 P-42; 30.4 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1) にて行った。

**【0514】****〔実施例 P-43〕**

3- {3- (ナフタレン-2-イル) -2- [4- (トリフルオロメチル) フェニルメチルオキシ] ピリジン-5-イル} プロピオン酸 (化合物番号 P-43) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 P-42 (29.5 mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.15 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 P-43; 24.1 mg) を得た。

**【0515】****〔実施例 P-1~50〕**

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-P-1~2 に示す。

**【0516】**



【表 29】

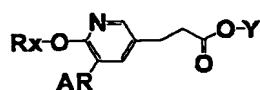


Table-P-1

Exp.	RxO	Y	AR	Syn	LCMS		
					method	RTime	Mass
P-1	cPenMeO	Et	2-Nap	P-1			
P-2	cPenMeO	H	2-Nap	P-2	A	5.60	376(M <sup>+</sup> +1)
P-3	cPenMeO	Et	5-Ind	P-1	A	5.37	393(M <sup>+</sup> +1)
P-4	cPenMeO	H	5-Ind	P-2			
P-5	cPenMeO	Et	1Me-5-Ind	P-1			
P-6	cPenMeO	H	1Me-5-Ind	P-2	A	4.90	379(M <sup>+</sup> +1)
P-7	cPenMeO	Et	1Me-5-Ind	P-1			
P-8	cPenMeO	H	5-1Hldz	P-2			
P-9	cPenMeO	Et	5-1Hldz	P-1			
P-10	cPenMeO	H	1Me-5-1Hldz	P-2			
P-11	cPenMeO	Et	5-Bzt	P-1			
P-12	cPenMeO	H	5-Bzt	P-2			
P-13	cPenMeO	Et	5-2ABzt	P-1			
P-14	cPenMeO	H	5-2ABzt	P-2			
P-15	cPenMeO	H	6-IQ	P-1,P-2	C		377(M <sup>+</sup> +1)
P-16	cPenO	H	2-Nap	P-1,P-2			
P-17	cPenO	H	5-Ind	P-1,P-2	C		351(M <sup>+</sup> +1)
P-18	cPenO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-19	cPenO	H	5-1Hldz	P-1,P-2			
P-20	cPenO	H	1Me-5-1Hldz	P-1,P-2			
P-21	cPenO	H	5-Bzt	P-1,P-2			
P-22	cPenO	H	5-2ABzt	P-1,P-2			
P-23	cHexO	H	2-Nap	P-1,P-2	A	5.51	376(M <sup>+</sup> +1)
P-24	cHexO	H	5-Ind	P-1,P-2			
P-25	cHexO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-26	cHexO	H	1Me-5-1Hldz	P-1,P-2			
P-27	2EtBuO	H	2-Nap	P-1,P-2	A	5.68	378(M <sup>+</sup> +1)
P-28	2EtBuO	H	5-Ind	P-1,P-2			
P-29	2EtBuO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-30	iBuO	H	2-Nap	P-1,P-2	A	5.13	350(M <sup>+</sup> +1)
P-31	iBuO	H	5-Ind	P-1,P-2			
P-32	iBuO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-33	iBuO	H	1Me-5-1Hldz	P-1,P-2			
P-34	BnO	H	2-Nap	P-1,P-2			
P-35	BnO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-36	(R)1PhEtO	Et	2-Nap	P-36			
P-37	(R)1PhEtO	H	2-Nap	P-37			
P-38	(S)1PhEtO	H	2-Nap	P-36,P37	A	5.31	398(M <sup>+</sup> +1)
P-39	(S)1PhEtO	H	1Me-5-Ind	P-36,P37	A	4.75	401(M <sup>+</sup> +1)
P-40	2MeBnO	H	2-Nap	P-1,P-2			
P-41	2MeBnO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			

【0517】

【表 30】

Table-P-2

P-42	4CF3BnO	Et	2-Nap	P-42			
P-43	4CF3BnO	H	2-Nap	P-43	A	5.52	452(M <sup>+</sup> +1)
P-44	4CF3BnO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-45	3PhBuO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-46	2(2-Nap)EtO	H	2-Nap	P-1,P-2			
P-47	2(2-Nap)EtO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			
P-48	2(2FPh)EtO	H	2-Nap	P-1,P-2			
P-49	2(2FPh)EtO	H	5-Ind	P-1,P-2	A	4.18	405(M <sup>+</sup> +1)
P-50	2(2FPh)EtO	H	1Me-5-Ind	P-1,P-2			

【実施例 Q-1】

3-[4-メトキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸

出証特 2004-3083702

メチル (中間体 49) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って中間体 21 (2.65 g)、2-ナフタレンボロン酸 (2.87 g)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (7.5 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (960 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 49; 2.47 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 80℃ で 15 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1) にて行った。

【0518】

3-[4-メトキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸 (中間体 50) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って中間体 49 (2.45 g) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (6.7 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 60; 1.96 g) を得た。ただし反応は 40 分間行った。

【0519】

3-[4-ヒドロキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸メチル (中間体 51) の合成

中間体 10 の合成法に記載の手順に従って、ピリジンおよび濃塩酸 (各 10 ml) および中間体 50 (1.00 g) を反応させ処理することにより粗粉末物質を得た。ただし反応は 3 時間行った。これを中間体 1 の合成法に記載の手順に従って塩化チオニル (282 μl) とメタノール中反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 51; 306 mg) を得た。

【0520】

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 Q-1) の合成

化合物番号 A-6 の合成法に記載の手順に従って中間体 51 (84 mg)、Ph<sub>3</sub>P (125 mg)、シクロペンタノール (50 μl) および 40% DIAD (224 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 Q-1; 90 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 15 時間半行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=19:1) にて行った。

【0521】

〔実施例 Q-2〕

3-[3-アミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 Q-2) の合成

化合物番号 Q-1 (59.1 mg) のメタノール (5 ml) 溶液に酸化白金 (5 mg、Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>) を加え水素雰囲気下室温にて 30 分間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=4:1) にて精製し標記化合物 (化合物番号 Q-2; 49 mg) を得た。

【0522】

〔実施例 Q-3〕

3-[3-アミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 Q-3) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 Q-2 (40 mg)、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (150 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 Q-3; 38 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

【0523】

〔実施例 Q-4〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インドール-5-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 Q-4) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 A-28 (187 mg)、5-インドールボロン酸 (143 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (400 μl) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (51 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 Q

ー4; 192 mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は80℃で16時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=4:1) にて行った。

**【0524】****〔実施例Q-5〕**

3-[3-アミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号Q-5) の合成  
化合物番号Q-2の合成法に記載の順に従って、化合物番号Q-4 (59.1 mg) および酸化白金 (5 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号Q-5; 49.3 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=2:1) にて行った。

**【0525】****〔実施例Q-6〕**

3-[3-アミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号Q-6) の合成  
中間体9の合成法に記載の順に従って化合物番号Q-5 (44 mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液 (150  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号Q-6; 41 mg) を得た。

**【0526】****〔実施例Q-8〕**

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号Q-8) の合成  
化合物番号C-1の合成法に記載の順に従って化合物番号A-28 (182 mg)、1-メチル-5-インダゾールボロン酸 (152 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (400  $\mu$ l) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (58.9 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号Q-8; 181 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は80℃で16時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=3:1) にて行った。

**【0527】****〔実施例Q-9〕**

3-[3-アミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号Q-9) の合成  
化合物番号Q-8 (578 mg) の酢酸エチル (2 ml) /メタノール (5 ml) 混合溶液にラネー2800ニッケル (230 mg) を加え、水素雰囲気下室温にて6時間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=2:1) にて精製し標記化合物 (化合物番号Q-9; 484 mg) を得た。

**【0528】****〔実施例Q-10〕**

3-[3-アミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号Q-10) の合成  
中間体9の合成法に記載の順に従って化合物番号Q-9 (56 mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (200  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号Q-10; 50 mg) を得た。

**【0529】****〔実施例Q-47〕**

3-[4-ベンジルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-ニトロフェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号Q-47) の合成  
化合物番号C-1の合成法に記載の順に従って化合物番号B-95 (6.00 g)、2-ナフタレンボロン酸 (4.11 g)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (13.5 ml) およ

び  $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  (1.36 g) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 Q-47; 5.81 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 80℃ で 12 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=8:1) にて行った。

**【0530】**

## 〔実施例 Q-48〕

3-[3-アミノ-4-ベンジルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 Q-48) の合成

化合物番号 Q-9 の合成法に記載の手順に従って、化合物番号 Q-47 (5.04 g) および ラネー 2800 ニッケル (2.50 g) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 Q-48; 4.21 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 20 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=2:1) にて行った。

**【0531】**

## 〔実施例 Q-1~52〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-Q-1 に示す。

**【0532】**

【表 31】

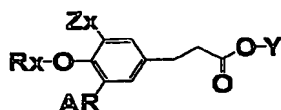


Table-Q-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
Q-1	cPenO	Me	NO2	2-Nap	Q-1			
Q-2	cPenO	Me	NH2	2-Nap	Q-2			
Q-3	cPenO	H	NH2	2-Nap	Q-3	A	4.78	376(M <sup>+</sup> +1)
Q-4	cPenO	Me	NO2	5-Ind	Q-4			
Q-5	cPenO	Me	NH2	5-Ind	Q-5			
Q-6	cPenO	H	NH2	5-Ind	Q-6	A	3.75	365(M <sup>+</sup> +1)
Q-7	cPenO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6	A	4.19	379(M <sup>+</sup> +1)
Q-8	cPenO	Me	NO2	1Me-5-1HIdz	Q-8			
Q-9	cPenO	Me	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-9			
Q-10	cPenO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-10			
Q-11	cPenO	H	NH2	5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-12	cPenO	H	NH2	5-Bzt	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-13	cPenO	H	NH2	5-2ABzt	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-14	cPenO	H	NH2	2Me-5-Bzt	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-15	cHexO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3	A	5.66	404(M <sup>+</sup> +1)
Q-16	cHexO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6			
Q-17	cHexO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-18	2EtBuO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3			
Q-19	2EtBuO	H	NH2	5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6	A	4.26	381(M <sup>+</sup> +1)
Q-20	2EtBuO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6			
Q-21	2EtBuO	H	NH2	5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-22	2EtBuO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-23	2EtBuO	H	NH2	5-Bzt	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-24	2EtBuO	H	NH2	5-2ABzt	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-25	2EtBuO	H	NH2	2Me-5-Bzt	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-26	iBuO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3	A	4.82	364(M <sup>+</sup> +1)
Q-27	iBuO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6			
Q-28	iBuO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10	A	3.66	368(M <sup>+</sup> +1)
Q-29	(S)1PhEtO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3	A	4.87	412(M <sup>+</sup> +1)
Q-30	(S)1PhEtO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6	A	4.31	415(M <sup>+</sup> +1)
Q-31	(S)1PhEtO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10	A	3.76	416(M <sup>+</sup> +1)
Q-32	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3	A	5.26	466(M <sup>+</sup> +1)
Q-33	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6	A	4.20	455(M <sup>+</sup> +1)
Q-34	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-35	2-IndanO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3	A	5.10	424(M <sup>+</sup> +1)
Q-36	2-IndanO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6	A	4.63	427(M <sup>+</sup> +1)
Q-37	2-IndanO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10	A	4.14	428 (M <sup>+</sup> +1)
Q-38	5OMe-2-IndanO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3			
Q-39	5,6(OMe)-2-IndanO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6			
Q-40	5F-2-IndanO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10			
Q-41	2(4FPh)EtO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3			
Q-42	2(4FPh)EtO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6			
Q-43	2(4FPh)EtO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10	A	4.48	448(M <sup>+</sup> +1)
Q-44	2(4DMAPh)EtO	H	NH2	2-Nap	Q-1,Q-2,Q-3	A	4.28	455(M <sup>+</sup> +1)
Q-45	2(4DMAPh)EtO	H	NH2	1Me-5-Ind	Q-4,Q-5,Q-6			
Q-46	2(4DMAPh)EtO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-8,Q-9,Q-10	A	3.12	459(M <sup>+</sup> +1)
Q-47	BnO	Me	NO2	2-Nap	Q-47			
Q-48	BnO	Me	NH2	2-Nap	Q-48			
Q-49	BnO	H	NH2	2-Nap	Q-3			
Q-50	BnO	Me	NO2	1Me-5-1HIdz	Q-47			

Q-51	BnO	Me	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-48			
Q-52	BnO	H	NH2	1Me-5-1HIdz	Q-10			

## 〔実施例 S-1〕

3- {4-ベンジルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-[N-(2, 2, 2-トリフルオロアセチル)アミノ]フェニル} プロピオン酸メチル (中間体 52) の合成  
化合物番号 B-103 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 Q-48 (4.18 g)、トリエチルアミン (4.65 ml) および無水トリフルオロ酢酸 (7.40 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 52; 4.72 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 1 時間半行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1) にて行った。

## 【0533】

3- {4-ヒドロキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-[N-(2, 2, 2-トリフルオロアセチル)アミノ]フェニル} プロピオン酸メチル (中間体 53) の合成  
中間体 52 (3.20 g) の酢酸エチル (50 ml) / メタノール (25 ml) 混合溶液に 10% パラジウム炭素 (98 mg) を加え、水素雰囲気下室温にて 2 時間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去して標記化合物 (中間体 53; 2.39 g) を得た。

## 【0534】

3- {4-シクロペンチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)-5-[N-(2, 2, 2-トリフルオロアセチル)アミノ]フェニル} プロピオン酸メチル (中間体 54) の合成  
化合物番号 A-6 の合成法に記載の手順に従って中間体 53 (84 mg)、 $\text{Ph}_3\text{P}$  (125 mg)、シクロペンタノール (50  $\mu\text{l}$ ) および 40% DIAD (224  $\mu\text{l}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 54; 90 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 1 時間半行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 19:1) にて行った。

## 【0535】

3- {4-シクロペンチルオキシ-3-[N-メチル-N-(2, 2, 2-トリフルオロアセチル)アミノ]-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル} プロピオン酸メチル (中間体 55) の合成  
中間体 54 (208 mg) の DMF (5 ml) 溶液に氷冷下 60% 水素化ナトリウム (21 mg) を加え 20 分間攪拌した。これにヨウ化メチル (150  $\mu\text{l}$ ) を滴下して 10 分攪拌した後、室温に昇温しさらに 1 時間攪拌した。反応混合液を氷水に注ぎ酢酸エチル (100 ml) を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 5:1) で精製し、標記化合物 (中間体 55; 200 mg) を得た。

## 【0536】

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(N-メチルアミノ)-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 S-1) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って中間体 55 (198 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (800  $\mu\text{l}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-1; 38 mg) を得た。ただし反応は 6 時間行った。

## 【0537】

## 〔実施例 S-3〕

3-[3-アセチルアミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 S-3) の合成  
化合物番号 Q-2 (81 mg) の塩化メチレン (2 ml) 溶液に N-メチルモルホリン (33  $\mu\text{l}$ 、WAKO) を加えた後、氷冷下、アセチルクロライド (22  $\mu\text{l}$ ) を加えた。10 分間攪拌後、室温に昇温し更に 1 時間攪拌した。反応混合液を炭酸水素ナトリウム水溶液 (100 ml) にあけ、酢酸エチル (150 ml) を加えて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を

留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号 S-3; 85 mg) を得た。

**【0538】**

## 〔実施例 S-4〕

3-[3-アセチルアミノ-4-シクロペンチルメチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 S-4) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 S-3 (80 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (400  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-4; 75 mg) を得た。ただし反応は 15 時間行った。

**【0539】**

## 〔実施例 S-5〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-ホルミルアミノ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 S-4) の合成

化合物番号 Q-2 (90 mg) の DMF (5 ml) 溶液に蟻酸 (200  $\mu$ l) 及び無水酢酸 (100  $\mu$ l) を混合したものを氷冷下加えた。10 分間攪拌後、室温に昇温し更に 18 時間攪拌した。反応混合液を炭酸水素ナトリウム水溶液 (100 ml) にあけ、酢酸エチル (150 ml) を加えて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1) で精製した。ここで得られた物質を中間体 9 の合成法に記載の手順に従って 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (400  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-5; 65 mg) を得た。

**【0540】**

## 〔実施例 S-6〕

3-[3-(2-アセトキシアセチルアミノ)-4-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 S-6) の合成

中間体 70 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 Q-2 (88 mg)、N-メチルモルホリン (36  $\mu$ l) およびアセトキシアセチルクロライド (35  $\mu$ l, Ald) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-6; 75 mg) を得た。

**【0541】**

## 〔実施例 S-7〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(2-ヒドロキシアセチルアミノ)-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 S-7) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 S-6 (102 mg)、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (500  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-7; 80 mg) を得た。ただし反応は 15 時間半行った。

**【0542】**

## 〔実施例 S-8〕

3-[3-カルバモイルアミノ-4-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 S-8) の合成

化合物番号 Q-2 (100 mg) の酢酸 (2 ml) - 精製水 (0.4 ml) 混合溶液にシアン酸カリウム (45 mg、和光純薬社製) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応混合液を氷を入れた水 (50 ml) に注ぎイソプロピルエーテル (150 ml x 2) で抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、有機層を乾燥後減圧下に溶媒留去した。ここで得られた物質を中間体 9 の合成法に記載の手順に従って 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (300  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-8; 70 mg) を得た。

**【0543】**

## 〔実施例 S-9〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-メチルスルホニルアミノ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 S-9) の合成

化合物番号 Q-2 (81 mg) の塩化メチレン (2 ml) 溶液に、ピリジン (300  $\mu$ l) を加えた後、氷冷下、メタンスルホニルクロライド (40  $\mu$ l) を加えた。10 分間攪拌した後、室温に昇温しさらに 2 時間攪拌した。反応混合液を 1 規定塩酸にあげ、酢酸エチル (150 ml) を加えて抽出し、これを飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、有機層を乾燥後減圧下にて溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 13:2) で精製し、標記化合物 (化合物番号 S-9; 96 mg) を得た。

#### 【0544】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3-メチルスルホニルアミノ-5-(ナフタレン-2-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 S-10) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 S-9 (81 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (400  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-10; 80 mg) を得た。ただし反応は室温で 17 時間半反応後、60℃にて 3 時間行った。

#### 【0545】

##### 【実施例 S-11】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3-(N, N-ジメチルスルファモイルアミノ) 5-(ナフタレン-2-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 S-11) の合成  
化合物番号 Q-2 (163 mg) のピリジン (5 ml) 溶液に 4-ジメチルアミノピリジン (104 mg、TCI)、ジメチルスルファモイルクロリド (520  $\mu$ l、TCI) を順次加え 5 日間攪拌した。反応混合液に水 (30 ml) および酢酸エチル (90 ml) を加え抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 6:1) で精製した。ここで得られた物質を中間体 9 の合成法に記載の手順に従って 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (300  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-11; 105 mg) を得た。

#### 【0546】

##### 【実施例 S-12】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3-(N, N-ジメチルアミノ) -5-(ナフタレン-2-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 S-12) の合成  
化合物番号 Q-2 (60 mg) の DMF (3 ml) 溶液に氷冷下 60% 水素化ナトリウム (26 mg) を加え 10 分間攪拌した。これにヨウ化メチル (100  $\mu$ l) を加えて 10 分攪拌した後、60℃に昇温しさらに 2 時間攪拌した。反応混合液を水 (20 ml) に注ぎ酢酸エチル (50 ml) を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 8:1) で精製した。ここで得られた物質を中間体 9 の合成法に記載の手順に従って 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (150  $\mu$ l) と反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 S-12; 46 mg) を得た。

#### 【0547】

3- {4-ベンジルオキシ-3-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル) -5-[N-(2, 2, 2-トリフルオロアセチル) アミノ] フェニル} プロピオン酸メチル (中間体 56) の合成

化合物番号 B-103 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 Q-51 (2.09 g)、トリエチルアミン (3.70 ml) および無水トリフルオロ酢酸 (2.35 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 56; 2.36 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 1 時間半行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 3:1) にて行った。

#### 【0548】

3- {4-ヒドロキシ-3-(1-メチル-1H-インダゾール-5-イル) -5-[N-(2, 2, 2-トリフルオロアセチル) アミノ] フェニル} プロピオン酸メチル (中



間体 57) の合成

中間体 56 (1.62 g) の酢酸エチル (10 ml) / メタノール (3 ml) 混合溶液に 10% パラジウム炭素 (29 mg) を加え、水素雰囲気下室温にて 17 時間攪拌した。反応混合液を濾過し、濾液の溶媒を減圧下留去して標記化合物 (中間体 57; 1.19 g) を得た。

【0549】

〔実施例 S-1 ~ 73〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-S-1 ~ 2 に示す。

【0550】

【表 3 2】

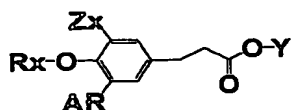


Table-S-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
S-1	cPenO	H	NHMe	2-Nap	S-1			
S-2	cPenO	H	NHEt	2-Nap	S-1			
S-3	cPenO	Me	NHAc	2-Nap	S-3			
S-4	cPenO	H	NHAc	2-Nap	S-4	C		421(M <sup>+</sup> +1)
S-5	cPenO	H	NHCHO	2-Nap	S-5	C		407(M <sup>+</sup> +1)
S-6	cPenO	H	NHCOCH <sub>2</sub> OAc	2-Nap	S-6			
S-7	cPenO	H	NHCOCH <sub>2</sub> OH	2-Nap	S-7	C		437(M <sup>+</sup> +1)
S-8	cPenO	H	NHCONH <sub>2</sub>	2-Nap	S-8	C		422(M <sup>+</sup> +1)
S-9	cPenO	Me	NHSO <sub>2</sub> Me	2-Nap	S-9			
S-10	cPenO	H	NHSO <sub>2</sub> Me	2-Nap	S-10	C		456(M <sup>+</sup> )
S-11	cPenO	H	NHSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-11	C		483(M <sup>+</sup> +1)
S-12	cPenO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12			
S-13	cPenO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1			
S-14	cPenO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12	C		407(M <sup>+</sup> +1)
S-15	cPenO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1	C		394(M <sup>+</sup> +1)
S-16	cPenO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-17	cPenO	H	NHMe	5-Bzt	S-1			
S-18	cPenO	H	NMe <sub>2</sub>	5-Bzt	S-12			
S-19	cPenO	H	NHMe	5-2ABzt	S-1			
S-20	cPenO	H	NMe <sub>2</sub>	5-2ABzt	S-12			
S-21	cPenO	H	NHMe	2Me-5-Bzt	S-1			
S-22	cPenO	H	NMe <sub>2</sub>	2Me-5-Bzt	S-12			
S-23	cPenMeO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1			
S-24	cPenMeO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12			
S-25	cPenMeO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1			
S-26	cPenMeO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-27	cHexO	H	NHMe	2-Nap	S-1			
S-28	cHexO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12			
S-29	cHexO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1	C		421(M <sup>+</sup> +1)
S-30	cHexO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12			
S-31	cHexO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1			
S-32	cHexO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-33	2EtBuO	H	NHMe	2-Nap	S-1	C		406(M <sup>+</sup> +1)
S-34	2EtBuO	H	NHMe	6-OMe-2-Nap	S-1			
S-35	2EtBuO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1			
S-36	2EtBuO	H	NHMe	5-Bzt	S-1			
S-37	2EtBuO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1			
S-38	iBuO	H	NHMe	2-Nap	S-1			
S-39	iBuO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12	C		392(M <sup>+</sup> +1)
S-40	iBuO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1	C		381(M <sup>+</sup> +1)
S-41	iBuO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12			
S-42	iBuO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1			
S-43	iBuO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-44	1PhEtO	H	NHMe	2-Nap	S-1	C		426(M <sup>+</sup> +1)
S-45	1PhEtO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12			

【0551】

【表 33】

Table-S-2

S-46	1PhEtO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1			
S-47	1PhEtO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12	C		443(M <sup>+</sup> +1)
S-48	1PhEtO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1	C		429(M <sup>+</sup> +1)
S-49	1PhEtO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-50	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NHMe	2-Nap	S-1			
S-51	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12			
S-52	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1			
S-53	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12	C		497(M <sup>+</sup> +1)
S-54	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1			
S-55	4CF <sub>3</sub> BnO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-56	2-IndanO	H	NHMe	2-Nap	S-1			
S-57	2-IndanO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12			
S-58	2-IndanO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1	C		441(M <sup>+</sup> +1)
S-59	2-IndanO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12			
S-60	2-IndanO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1	A	4.16	442(M <sup>+</sup> +1)
S-61	2-IndanO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12	A	4.18	456(M <sup>+</sup> +1)
S-62	2(4FPh)EtO	H	NHMe	2-Nap	S-1			
S-63	2(4FPh)EtO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12	C		458(M <sup>+</sup> +1)
S-64	2(4FPh)EtO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1	C		447(M <sup>+</sup> +1)
S-65	2(4FPh)EtO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12			
S-66	2(4FPh)EtO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1			
S-67	2(4FPh)EtO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			
S-68	2(4DMAPh)EtO	H	NHMe	2-Nap	S-1	C		469(M <sup>+</sup> +1)
S-69	2(4DMAPh)EtO	H	NMe <sub>2</sub>	2-Nap	S-12			
S-70	2(4DMAPh)EtO	H	NHMe	1Me-5-Ind	S-1			
S-71	2(4DMAPh)EtO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-Ind	S-12	C		486(M <sup>+</sup> +1)
S-72	2(4DMAPh)EtO	H	NHMe	1Me-5-1HIdz	S-1	C		473(M <sup>+</sup> +1)
S-73	2(4DMAPh)EtO	H	NMe <sub>2</sub>	1Me-5-1HIdz	S-12			

## 【実施例 T-1】

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-ヒドロキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号T-1)の合成

化合物番号Q-2(403mg)の酢酸(1.5ml)溶液に20%硫酸(1.0ml)を加えた。ここに亜硝酸ナトリウム(76mg)の水溶液(0.5ml)を反応液温10℃以下に保ちながら10分間かけて滴下し更に5分間攪拌した。この反応溶液をあらかじめ酢酸ナトリウム(328mg)の酢酸溶液(3.5ml)を100℃に加熱攪拌しておいたものに5分間かけて滴下し、更に10分間加熱攪拌した。反応溶液を氷水(50ml)に注ぎイソプロピルエーテル(100ml×2)にて抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した後、乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製した。ここで得られた物質を中間体9の合成法に記載の手順に従って2規定水酸化ナトリウム水溶液(500μl)と反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号T-1; 78mg)を得た。

## 【0552】

## 【実施例 T-2】

3-[3-アセトキシ-4-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸エチル(中間体58)の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号B-114(160mg)、2-ナフタレンボロン酸(382mg、Alid)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0.7ml)および(PH<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(105mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体58; 152mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は13時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=9:1)にて行った。

## 【0553】

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-ヒドロキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号T-2)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って中間体58(146mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(0.35ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号T-2; 135mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

## 【0554】

## 〔実施例T-31〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-メトキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸エチル(化合物番号T-31)の合成  
化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号A-25(210mg)、2-ナフタレンボロン酸(184mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0.5ml)および $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$ (65.3mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号T-31; 181mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は14時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=9:1)にて行った。

## 【0555】

## 〔実施例T-32〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-メトキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号T-32)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号T-31(166mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(0.45ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号T-32; 135mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

## 【0556】

## 〔実施例T-33〕

4-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-3-(1H-インドール-5-イル)-5-メトキシベンズアルデヒド(中間体59)の合成  
化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って、5-インドールボロン酸(1.29g)、中間体16(1.75g)、2M炭酸ナトリウム水溶液(4.8ml)および $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$ (400mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体59; 910mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は12.5時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=7:1)にて行った。

## 【0557】

3-[4-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-3-(1H-インドール-5-イル)-5-メトキシフェニル]アクリル酸エチル(中間体60)の合成  
中間体7の合成法に記載の手順に従って中間体59(910mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル(500 $\mu$ l)および60%水素化ナトリウム(100mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体60; 945mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は1.5時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて行った。

## 【0558】

3-[4-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)-3-(1H-インドール-5-イル)-5-メトキシフェニル]プロピオン酸エチル(中間体61)の合成  
中間体8の合成法に記載の手順に従って中間体60(945mg)および10%パラジウム炭素(95mg)を水素ガス雰囲気下、反応させ処理することにより標記化合物(中間体61; 940mg)を得た。

## 【0559】

3-[4-ヒドロキシ-3-(1H-インドール-5-イル)-5-メトキシフェニル]プロピオン酸エチル(中間体62)の合成  
中間体19の合成法に記載の手順に従って、中間体61(750mg)およびテトラブチ

ルアンモニウムフルオリド/THF 1M溶液 (5.0 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 62; 555 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 1.5 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1) にて行った。

**【0560】**

3- [4-シクロペンチルオキシ-3- (1H-インドール-5-イル) -5-メトキシフェニル] プロピオン酸エチル (化合物番号 T-33) の合成  
化合物番号 A-6 の合成法に記載の手順に従って中間体 62 (340 mg)、Ph<sub>3</sub>P (1.31 g)、シクロペンタノール (450 μl) および TMAD (860 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 T-33; 376 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 16 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quads、ヘキサン: 酢酸エチル = 7:1) にて行った。

**【0561】****〔実施例 T-34〕**

3- [4-シクロペンチルオキシ-3- (1H-インドール-5-イル) -5-メトキシフェニル] プロピオン酸 (化合物番号 T-34) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 T-33 (99 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (500 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 T-34; 76 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

**【0562】****〔実施例 T-1 ~ 61〕**

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-T-1 ~ 2 に示す。

**【0563】**

【表 34】

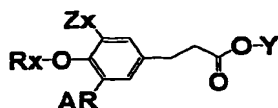


Table-T-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
T-1	cPenMeO	H	OH	2-Nap	T-1	A	5.03	382(M <sup>+</sup> +1)
T-2	cPenO	H	OH	2-Nap	T-2			
T-3	cPenO	H	OH	5-Ind	Int73,T-2	C		366(M <sup>+</sup> +1)
T-4	cPenO	H	OH	1Me-5-Ind	Int73,T-2			
T-5	cPenO	H	OH	5-1HIdz	Int73,T-2			
T-6	cPenO	H	OH	1Me-5-Idz	Int73,T-2	C		381(M <sup>+</sup> +1)
T-7	cHexO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-8	cHexO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1			
T-9	cHexO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-10	2EtBuO	H	OH	2-Nap	T-1	C		393(M <sup>+</sup> +1)
T-11	2EtBuO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1			
T-12	2EtBuO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-13	iBuO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-14	iBuO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1			
T-15	iBuO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-16	1PhEtO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-17	1PhEtO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1	C		416(M <sup>+</sup> +1)
T-18	1PhEtO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-19	4CF <sub>3</sub> BnO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-20	4CF <sub>3</sub> BnO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1			
T-21	4CF <sub>3</sub> BnO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-22	2-IndanO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-23	2-IndanO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1			
T-24	2-IndanO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1	A	3.91	429(M <sup>+</sup> +1)
T-25	2(4FPh)EtO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-26	2(4FPh)EtO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1			
T-27	2(4FPh)EtO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-28	2(4DMAPh)EtO	H	OH	2-Nap	T-1			
T-29	2(4DMAPh)EtO	H	OH	1Me-5-Ind	T-1	C		459(M <sup>+</sup> +1)
T-30	2(4DMAPh)EtO	H	OH	1Me-5-Idz	T-1			
T-31	cPenO	Et	OMe	2-Nap	T-31			
T-32	cPenO	H	OMe	2-Nap	T-32			
T-33	cPenO	Et	OMe	5-Ind	T-33			
T-34	cPenO	H	OMe	5-Ind	T-34			
T-35	cPenO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34	A	4.72	394(M <sup>+</sup> +1)
T-36	cPenO	H	OMe	5-1HIdz	T-31,T-32			
T-37	cPenO	H	OMe	1Me-5-Idz	T-31,T-32			
T-38	cHexO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32	C		405(M <sup>+</sup> +1)
T-39	cHexO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34			
T-40	cHexO	H	OMe	1Me-5-Idz	T-31,T-32			
T-41	2EtBuO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32			
T-42	2EtBuO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34			
T-43	2EtBuO	H	OMe	1Me-5-Idz	T-31,T-32			

【0564】

【表 35】

Table-T-2

T-44	iBuO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32			
T-45	iBuO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34	C		382(M <sup>+</sup> +1)
T-46	iBuO	H	OMe	1Me-5-1HIdz	T-31,T-32			
T-47	1PhEtO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32			
T-48	1PhEtO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34			
T-49	1PhEtO	H	OMe	1Me-5-1HIdz	T-31,T-32	C		431(M <sup>+</sup> +1)
T-50	4CF <sub>3</sub> BnO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32			
T-51	4CF <sub>3</sub> BnO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34			
T-52	4CF <sub>3</sub> BnO	H	OMe	1Me-5-1HIdz	T-31,T-32			
T-53	2-IndanO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32			
T-54	2-IndanO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34			
T-55	2-IndanO	H	OMe	1Me-5-1HIdz	T-31,T-32	C		443(M <sup>+</sup> +1)
T-56	2(4FPh)EtO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32			
T-57	2(4FPh)EtO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34	C		448(M <sup>+</sup> +1)
T-58	2(4FPh)EtO	H	OMe	1Me-5-1HIdz	T-31,T-32			
T-59	2(4DMAPh)EtO	H	OMe	2-Nap	T-31,T-32	C		470(M <sup>+</sup> +1)
T-60	2(4DMAPh)EtO	H	OMe	1Me-5-Ind	T-33,T-34			
T-61	2(4DMAPh)EtO	H	OMe	1Me-5-1HIdz	T-31,T-32			

## 【実施例 U-1】

4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニルアセトニトリル (中間体 63) の合成

化合物番号 C-1 (172 mg) の脱水 THF (5 ml) 溶液に氷冷下、トリメチルシリルニトリル (133  $\mu$ l、TCI) およびヨウ化亜鉛 (16 mg、WAKO) をアルゴンガス雰囲気下、順次加え 15 分間攪拌した後、室温に昇温しさらに 27 時間攪拌した。反応混合液に酢酸エチル (90 ml) を加え、これを飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣の無水塩化メチレン (5 ml) 溶液に氷冷下、トリエチルシラン (240  $\mu$ l、TCI) および三フッ化ホウ素ジエチルエーテル錯体 (366  $\mu$ l、TCI) をアルゴンガス雰囲気下加え、室温まで昇温して 3.5 時間攪拌した。反応混合液を氷水 (50 ml) に注ぎ酢酸エチル (90 ml) にて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン：酢酸エチル=10:1) で精製し、標記化合物 (中間体 63; 116 mg) を得た。

## 【0565】

4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル酢酸 (化合物番号 U-1) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って中間体 63 (110 mg) および 5 規定水酸化ナトリウム水溶液 (900  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 U-1; 62 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は加熱還流下 24 時間行った。精製をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン：酢酸エチル=2:1) にて行った。

## 【0566】

## 【実施例 U-10】

4-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル]酪酸メチル (化合物番号 U-10) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 F-1 (355 mg)、2-ナフタレンボロン酸 (344 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液 (2.1 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (115 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 U-10; 392 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 18 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン：イソプロピルエーテル=8:1) にて行った。

## 【0567】

## 【実施例 U-11】

4-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(ナフタレン-2-イル)フェニル]酪酸  
(化合物番号 U-11) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 U-10 (380 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (1.0 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 U-11; 342 mg) を得た。ただし反応は 3.5 時間行った。

【0568】

## 【実施例 U-1~18】

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-U-1 に示す。

【0569】

【表 36】

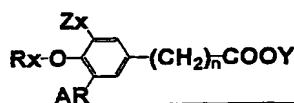


Table-U-1

Exp.	RxO	Y	Zx	n	AR	Syn	LCMS		
							method	RTime	Mass
U-1	cHexMeO	H	H	1	2-Nap	U-1	C		374(M <sup>+</sup> )
U-2	cHexMeO	H	H	1	1Me-5-Ind	Int63,U-1			
U-3	cHexMeO	H	H	1	1Me-5-Idz	Int63,U-1			
U-4	cPenMeO	H	H	1	2-Nap	Int63,U-1	C		360(M <sup>+</sup> )
U-5	cPenMeO	H	H	1	1Me-5-Ind	Int63,U-1			
U-6	cPenO	H	H	1	2-Nap	Int63,U-1			
U-7	cPenO	H	H	1	1Me-5-Ind	Int63,U-1	C		349(M <sup>+</sup> )
U-8	2(4FPh)EtO	H	H	1	2-Nap	Int63,U-1			
U-9	2(4FPh)EtO	H	H	1	1Me-5-Ind	Int63,U-1			
U-10	cPenMeO	Me	H	3	2-Nap	U-10	C		374(M <sup>+</sup> )
U-11	cPenMeO	H	H	3	2-Nap	U-11	C		374(M <sup>+</sup> )
U-12	cPenMeO	H	H	3	1Me-5-Ind	U-10,U-11			
U-13	cPenO	H	H	3	2-Nap	U-10,U-11			
U-14	cPenO	H	H	3	1Me-5-Ind	U-10,U-11	C		377(M <sup>+</sup> )
U-15	cHexO	H	H	3	2-Nap	U-10,U-11			
U-16	cHexO	H	H	3	1Me-5-Ind	U-10,U-11			
U-17	2(4FPh)EtO	H	H	3	2-Nap	U-10,U-11			
U-18	2(4FPh)EtO	H	H	3	1Me-5-Ind	U-10,U-11			

## 【実施例 V-1】

3-[4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-1-イル)フェニル]アクリル酸エチル (中間体 64) の合成

中間体 7 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 C-2 (361 mg)、ジエチルホスホノ酢酸エチル (240 μl)、60%水素化ナトリウム (69 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 64; 377 mg) を得た。ただし反応は 1 時間行った。

3-[4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-1-イル)フェニル]プロピオン酸エチル (化合物番号 V-1) の合成

中間体 8 の合成法に記載の手順に従って中間体 64 (361 mg) および 10%パラジウム炭素 (49 mg) を水素雰囲気下反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-1; 344 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 1.5 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=10:1) にて行った。

【0570】

## 【実施例 V-2】

3-[4-シクロヘキシルメチルオキシ-3-(ナフタレン-1-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 V-2) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-1 (332 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (900 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-2; 295 mg) を得た。ただし反応は 1.5 時間行った。

【0571】



## 【実施例 V-3】

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(6-ヒドロキシナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸メチル(化合物番号 V-3)の合成

2-プロモ-6-ヒドロキシナフタレン(243 mg、TCI)の無水 THF (10 ml) 溶液にアルゴンガス雰囲気下-78℃に冷却して n-ブチルリチウム/ヘキサン 1.6 M 溶液(1.18 ml)を20分かけて滴下し30分間攪拌した。ここに (<sup>i</sup>PrO)<sub>3</sub>B (1.73 ml)を10分かけて滴下し30分間攪拌した後、室温に昇温してさらに2時間攪拌した。反応混合液に0.5 M 硫酸水溶液(2 mL)を加えジエチルエーテル(40 ml×3)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去して粗 6-ヒドロキシ-2-ナフタレンボロン酸(378 mg)を得た。このエタノール(1 ml)溶液と化合物番号 A-1(230 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液(2.4 ml)をトルエン(3 ml)および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (115 mg)を加え100℃で13時間攪拌した。反応混合液に酢酸エチル(100 ml)を加え、飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=6:1)で精製し、標記化合物(化合物番号 V-3; 270 mg)を得た。

## 【0572】

## 【実施例 V-4】

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(6-ヒドロキシナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸(化合物番号 V-4)の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-3 (149 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液(370 μl)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号 V-4; 117 mg)を得た。ただし反応は14時間行った。

## 【0573】

## 【実施例 V-5】

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(5-ヒドロキシナフタレン-2-イル)フェニル〕プロピオン酸メチル(化合物番号 V-5)の合成

2-アミノ-5-ヒドロキシナフタレン(4.80 g、TCI)を6規定塩酸(300 ml)に溶かし、氷冷下で亜硝酸ナトリウム(2.25 g)の水溶液(22.5 ml)を30分かけて滴下し30分攪拌した。反応混合液にヨウ化カリウム(9.90 g、WAKO)の水溶液(75 ml)を滴下し30分攪拌後、室温に昇温しさらに3時間半攪拌した。反応混合液をアンモニア水溶液で中和した後、セライトを用いて濾過した。濾液に酢酸エチル(90 ml×2)を加え抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製して1-ヒドロキシ-6-ヨードナフタレン(1.48 g)を得た。これ(539 mg)の無水 THF (10 ml)溶液に氷冷下、60%水素化ナトリウム(171 mg)を加え1時間攪拌した。反応混合液をアルゴンガス雰囲気下-78℃に冷却し n-ブチルリチウム/ヘキサン 1.6 M 溶液(3.75 ml)を10分かけて滴下し30分間攪拌した。ここに (<sup>i</sup>PrO)<sub>3</sub>B (1.16 ml)を10分かけて滴下し30分間攪拌した後、室温に昇温しさらに3時間攪拌した。反応混合液に水3 ml および 0.5 M 硫酸水溶液(7 ml)を加えジエチルエーテル(100 ml×3)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去し粗 7-ヒドロキシ-2-ナフタレンボロン酸を得た。このエタノール(1 ml)溶液、化合物番号 A-1(350 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液(2.4 ml)および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (116 mg)を化合物番号 V-3 の合成法に記載の手順に従って反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号 V-5; 388 mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は14時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1)にて行った。

## 【0574】

## 【実施例 V-6】

3- [4-シクロペンチルメチルオキシ-3- (5-ヒドロキシナフタレン-2-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-6) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-5 (355 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (1.75 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-6; 158 mg) を得た。ただし反応は 12 時間行った。

【0575】

〔実施例 V-7〕

3- [4-シクロペンチルメチルオキシ-3- (7-ヒドロキシナフタレン-2-イル) フェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号 V-7) の合成

化合物番号 V-5 の合成法に記載の手順に従って 2-ブロモ-7-ヒドロキシナフタレン (559 mg, MAYB)、n-ブチルリチウム/ヘキサン 1.6 M 溶液 (3.91 ml) および  $(i\text{PrO})_3\text{B}$  (1.16 ml) から調製した粗 7-ヒドロキシ-2-ナフタレンボロン酸と化合物番号 A-1 (386 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液 (4.0 ml)、 $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  (195 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-7; 460 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 4 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 6:1) にて行った。

【0576】

〔実施例 V-8〕

3- [4-シクロペンチルメチルオキシ-3- (7-ヒドロキシナフタレン-2-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-8) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-7 (176 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (436  $\mu\text{l}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-8; 109 mg) を得た。ただし反応は 27 時間行った。

【0577】

〔実施例 V-11〕

3- [4-シクロヘキシルメチルオキシ-3- [6- (N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ) ナフタレン-2-イル] フェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号 V-11) の合成

化合物番号 V-3 (185 mg) の DMF (5 ml) 溶液に炭酸カリウム (274 mg)、2-クロロ-N, N-ジメチルアセトアミド (411  $\mu\text{l}$ 、KANTO) を加え 50 °C で 18 時間攪拌した。反応混合液に酢酸エチル (90 ml) を加え飽和食塩水で洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣を P T L C (クロロホルム: メタノール = 10:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号 V-11; 213 mg) を得た。

【0578】

〔実施例 V-12〕

3- [4-シクロヘキシルメチルオキシ-3- [6- (N, N-ジメチルカルバモイルメチルオキシ) ナフタレン-2-イル] フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-10) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-11 (213 mg)、2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (420  $\mu\text{l}$ ) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-12; 115 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は室温にて 18 時間、60 °C にて 8 時間行った。精製は P T L C (クロロホルム: メタノール = 10:1) にて行った。

【0579】

〔実施例 V-13〕

3- [3- (6-アミノナフタレン-2-イル) -4-シクロペンチルメチルオキシフェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号 V-13) の合成

文献 [アンダーソン (L. C. Anderson) ら、ジャーナル・オブ・ザ・アメリカン・ケミカル・ソサイエティ (J. Am. Chem. Soc)、1943 年、65 巻、2

41頁] 公知の方法で市販の2-ブロモ-6-ヒドロキシナフタレン(TCI)から得られる2-アミノ-6-ブロモナフタレン(223mg)の無水THF(10ml)溶液に氷冷下、30%水素化カリウム(191mg、Ald)を加え1時間攪拌した。反応混合液をアルゴンガス雰囲気下-78℃に冷却してt-ブチルリチウム/ペンタン1.7M溶液(1.88ml)を10分かけて滴下し30分間攪拌した。ここに(*i*PrO)<sub>3</sub>B(0.92ml)を10分かけて滴下し30分間攪拌した後、室温に昇温してさらに3時間攪拌した。反応混合液に水3mlおよび0.5M硫酸水溶液(4ml)を加えジエチルエーテル(100ml×3)で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去し粗6-アミノ-2-ナフタレンボロン酸(402mg)を得た。このエタノール(0.5ml)溶液、化合物番号A-1(119mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液(1.5ml)および(Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd(61mg)を化合物番号V-3の合成法に記載の手順に従って反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-13; 129mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は13時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)にて行った。

## 【0580】

## [実施例V-14]

3-[3-(6-アミノナフタレン-2-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル]プロピオン酸(化合物番号V-14)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-13(120mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(1.75ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-14; 89mg)を得た。ただし反応は14時間行った。

## 【0581】

## [実施例V-16]

3-(3-{6-[2-(アセチルオキシ)アセチルアミノ]ナフタレン-2-イル}-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル)プロピオン酸メチル(中間体65)の合成  
化合物番号V-13(151mg)のジクロロメタン(4ml)溶液にN-メチルモルホリン(50μl)を加えた後、氷冷下、アセチルオキシアセチルクロリド(48.3μl)を加えた。10分間攪拌後、室温に昇温し更に4時間攪拌した。反応混合液を炭酸水素ナトリウム水溶液(100ml)にあけ、酢酸エチル(150ml)を加えて抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をPTLC(ヘキサン:酢酸エチル=1:1)で精製し、標記化合物(中間体88; 136mg)を得た。

## 【0582】

3-(4-シクロペンチルメチルオキシ-3-{6-[2-(ヒドロキシアセチル)アミノ]ナフタレン-2-イル}フェニル)プロピオン酸(化合物番号V-16)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って中間体65(135mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(1.12ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-16; 102mg)を得た。ただし反応は室温にて5時間、60℃にて1時間行った。

## 【0583】

## [実施例V-18]

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(6-メチルスルホニルアミノナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-18)の合成  
化合物番号V-13(149.1mg)の1,2-ジクロロエタン(5ml)溶液に氷冷下、ピリジン(500μl)およびメタンスルホニルクロリド(62μl)を順次加え1.5時間攪拌した後、室温に昇温して12時間攪拌した。反応混合液に水(30ml)および酢酸エチル(90ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をPTLC(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製し、標記化合物(化合物番号V-18; 126mg)を得た。

## 【0584】

## 【実施例 V-19】

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(6-メチルスルホニルアミノナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号V-19)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-18(129mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(535 $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-19; 98mg)を得た。ただし反応は室温にて3時間、60℃にて1時間行った。

## 【0585】

## 【実施例 V-20】

3-{4-シクロペンチルメチルオキシ-3-[6-(N,N-ジメチルスルファモイルアミノ)ナフタレン-2-イル]フェニル}プロピオン酸メチル(化合物番号V-20)の合成  
化合物番号V-13(165mg)のピリジン(5ml)溶液に4-ジメチルアミノピリジン(104mg、TCI)、ジメチルスルファモイルクロリド(520 $\mu$ l、TCI)を順次加え5日間撹拌した後、50℃でさらに4時間撹拌した。反応混合液に水(30ml)および酢酸エチル(90ml)を加え抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1)で精製し、標記化合物(化合物番号V-20; 125mg)を得た。

## 【0586】

## 【実施例 V-21】

3-{4-シクロペンチルメチルオキシ-3-[6-(N,N-ジメチルスルファモイルアミノ)ナフタレン-2-イル]フェニル}プロピオン酸(化合物番号V-21)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-20(118mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(460 $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-21; 87mg)を得た。ただし反応は1.5時間行った。

## 【0587】

## 【実施例 V-22】

2-ブromo-6-スルファモイルアミノナフタレン(中間体66)の合成  
イソシアン酸クロロスルホニル(870 $\mu$ l、WAKO)のベンゼン(10ml)溶液に氷冷下でギ酸(377 $\mu$ l、WAKO)を滴下し室温まで昇温して19時間半撹拌した後、40℃に昇温してさらに4時間撹拌した。反応混合液に氷冷下、2-アミノ-6-ブromoナフタレン(443mg)のベンゼン溶液(5ml)を滴下し室温に昇温して21.5時間撹拌した。反応混合液を濾過して得た固体に酢酸エチルを加え混合し再び濾過を行い、濾液を減圧下、溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製し、標記化合物(中間体66; 158mg)を得た。

## 【0588】

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(6-スルファモイルアミノナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-22)の合成  
文献[宮浦(N. Miyaura)ら、テトラヘドロン・レターズ(Tetrahedron Lett.)、1997年、3447頁]に記載の手順に従って、化合物番号A-1(209mg)、ビスピナコレートジボロン(177mg、Ald)、[1,1'-ビス(ジフェニルホスフォノ)フェロセン]パラジウム(II)ジクロリド[以下「PdCl<sub>2</sub>(dppf)」と略す](28mg、TCI)および酢酸カリウム(182.3mg、Ald)をDMF(6ml)に加え、アルゴンガス雰囲気下80℃で5時間加熱撹拌した。反応混合液を室温まで降温した後、中間体91(130mg)、PdCl<sub>2</sub>(dppf)(30mg)および2M炭酸ナトリウム水溶液(0.9ml)を加え、アルゴンガス雰囲気下80℃で21時間加熱撹拌した。反応混合液に酢酸エチル(100ml)を加え飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=3:1)で精製し、標記化合物(化合物番号V-22; 46mg)を得た。

## 【0589】

## 〔実施例V-23〕

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(6-スルファモイルアミノナフタレン-2-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号V-23)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-22(41mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(340 $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-23; 22mg)を得た。ただし反応は24時間行った。

## 【0590】

## 〔実施例V-27〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-27)の合成  
化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号A-5(367mg)、5-インドールボロン酸(310mg、Frontier社製)、2M炭酸ナトリウム水溶液(0.9ml)および( $\text{Ph}_3\text{P}$ ) $_4\text{Pd}$ (132mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-27; 340mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は80℃で5時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

## 【0591】

## 〔実施例V-28〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号V-28)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-27(330mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液(1.40ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-28; 310mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

## 【0592】

## 〔実施例V-29〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1-メチル-1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-29)の合成  
化合物番号V-27(123mg)のDMF(5ml)溶液に氷冷下60%水素化ナトリウム(19mg)を加え10分間撹拌した。これにヨウ化メチル(100 $\mu$ l)を滴下して10分撹拌した後、室温に昇温しさらに1時間撹拌した。反応混合液を氷水に注ぎ酢酸エチル(100ml)を加え抽出した。有機層を飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=8:1)で精製し、標記化合物(化合物番号V-29; 126mg)を得た。

## 【0593】

## 〔実施例V-30〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1-メチル-1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号V-30)の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-29(123mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(330 $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-30; 110mg)を得た。ただし反応は1時間行った。

## 【0594】

## 〔実施例V-31〕

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(1H-インドール-4-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-31)の合成  
化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号A-1(200mg)、文献[ドール(M. Doll)ら、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー(J. Org. Chem)、1999年、64巻、1372頁]公知の方法で4-プロモインドール(TCI)より得られる4-インドールボロン酸(170mg)、2M炭酸ナトリウム

水溶液 (550  $\mu$ l) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (60 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-31; 214 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 21 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 6:1) にて行った。

## 【0595】

## 〔実施例 V-32〕

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(1H-インドール-4-イル) フェニル〕プロピオン酸 (化合物番号 V-32) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-31 (210 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.60 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-32; 173 mg) を得た。ただし反応は 1 時間行った。

## 【0596】

## 〔実施例 V-33〕

4-プロモ-1-メチル-1H-インドール (中間体 67) の合成

化合物番号 V-29 の合成法に記載の手順に従って 4-プロモインドール (5 g)、60 % 水素化ナトリウム (1.14 g) および ヨウ化メチル (3.18 ml、TCI) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体 67; 4.95 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 30 分間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1) にて行った。

## 【0597】

1-メチル-1H-インドール-4-ボロン酸 (中間体 68) の合成

中間体 67 (4.90 g) の無水 THF (30 ml) 溶液をアルゴンガス雰囲気下 -78 °C に冷却した後 t-ブチルリチウム/ペンタン 1.62 M 溶液 (28.8 ml) を 30 分かけて滴下し 30 分間攪拌した。ここに (iPrO)<sub>3</sub>B (10.77 ml) を 10 分かけて滴下し 1 時間攪拌した後、室温に昇温しさらに 2.5 時間攪拌した。反応混合液を氷を加えた 1.2 規定リン酸水溶液 (250 ml) に注ぎジエチルエーテル (200 ml × 3) で抽出した。有機層を 0.4 規定水酸化ナトリウム水溶液 (150 ml × 3) で抽出し水層を氷冷下 5 規定塩酸水にて酸性にして再びジエチルエーテル (200 ml × 3) にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をヘキサンにて洗浄して標記化合物 (中間体 68; 3.17 g) を得た。

## 【0598】

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(1-メチル-1H-インドール-4-イル) フェニル〕プロピオン酸メチル (化合物番号 V-33) の合成

化合物番号 C-1 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 A-1 (200 mg)、中間体 68 (185 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液 (550  $\mu$ l) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (60 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-33; 208 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 18 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 9:1) にて行った。

## 【0599】

## 〔実施例 V-34〕

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(1-メチル-1H-インドール-4-イル) フェニル〕プロピオン酸 (化合物番号 V-34) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-33 (200 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (0.60 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-34; 182 mg) を得た。ただし反応は 3 時間行った。

## 【0600】

## 〔実施例 V-43〕

3-〔4-シクロペンチルメチルオキシ-3-[1-(2-ヒドロキシエチル)-1H-インドール-5-イル] フェニル〕プロピオン酸 (化合物番号 V-43) の合成

化合物番号 V-29 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-27 (144 mg)、

60%水素化ナトリウム (38 mg) およびエチルプロモアセテート (160  $\mu$ l、TCI) を反応させ処理することにより油脂状物質を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は1.5時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=8:1) にて行った。これを中間体9の合成法に記載の手順に従って、2規定水酸化ナトリウム水溶液 (300  $\mu$ l) と反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号V-43; 36 mg) を得た。ただし反応は1時間行った。

**【0601】****【実施例V-44】**

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(3-ホルミル-1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号V-44) の合成  
化合物番号V-27 (75 mg) のDMF (6 ml) 溶液に氷冷下、塩化ホスホリル (30  $\mu$ l、TCI) を滴下し1時間攪拌後、35℃に昇温しさらに1時間攪拌した。反応混合液に氷を入れた1規定水酸化ナトリウム水溶液 (3 ml) を加え酢酸エチル (90 ml) にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=5:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号V-44; 86 mg) を得た。

**【0602】****【実施例V-45】**

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(3-ホルミル-1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号V-45) の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-44 (86 mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (110  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号V-45; 60 mg) を得た。ただし反応は3時間行った。

**【0603】****【実施例V-47】**

3-[3-(3-アセチル-1H-インドール-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号V-47) の合成  
化合物番号V-27 (98 mg) の塩化メチレン (2 ml) 溶液に塩化アルミニウム (81 mg、Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>)、塩化アセチル (60  $\mu$ l) を加え4時間攪拌した。反応混合液に1規定塩酸 (2 ml) を加え塩化メチレン (60 ml) にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル=4:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号V-47; 47 mg) を得た。

**【0604】****【実施例V-48】**

3-[3-(3-アセチル-1H-インドール-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル]プロピオン酸 (化合物番号V-48) の合成  
中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-47 (45 mg)、2規定水酸化ナトリウム水溶液 (110  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号V-48; 44 mg) を得た。ただし反応は4時間行った。

**【0605】****【実施例V-50】**

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(3-メチル-1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号V-50) の合成  
文献 [ウェイランド (E. N. Wayland) ら、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー (J. Org. Chem)、1967年、32巻、828頁] 公知の方法で5-プロモインドール (TCI) より得られる5-プロモ-3-メチルインドール (1.63 g) を中間体95の合成法に記載の手順に従って30%水素化カリウム (1.08 g)、*t*-ブチルリチウム/ペンタン 1.7M溶液 (9.7 ml) および (iPrO)<sub>3</sub>B (3.75 ml) から粗3-メチル-5-インドールボロン酸を調製した。これと化合物番

号 A-1 (803 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (2 ml) および  $(Ph_3P)_4Pd$  (241 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-50; 552 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 13 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1) にて行った。

**【0606】****【実施例 V-51】**

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(3-メチル-1H-インドール-5-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 V-51) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-50 (130 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (370  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-51; 127 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

**【0607】****【実施例 V-54】**

4-ブromo-1H-インダゾール (中間体 69) の合成

文献 [シューマン (P. Schumann) ら、バイオオーガニック & メディシナル・ケミストリー・レターズ (Bioorg. Med. Chem. Lett.)、2001 年、11 巻、1153 頁] 公知の方法に準じて市販の 3-プロモトルイジン (4.51 g、Ald) から標記化合物 (中間体 69; 1.68 g) を得た。

**【0608】**

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インダゾール-4-イル)フェニル]プロピオン酸メチル (化合物番号 V-54) の合成

化合物番号 V-22 の合成法に記載の手順に従って、化合物番号 A-5 (328 mg)、ビスピナコレートジボロン (281 mg)、 $PdCl_2(dppf)$  (61 mg)、酢酸カリウム (303 mg) を 80℃ で 4 時間反応させた後、この反応混合液に中間体 105 (161 mg)、 $PdCl_2(dppf)$  (64 mg) および 2M炭酸ナトリウム水溶液 (1.5 ml) を加え、80℃ で 9 時間反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-54; 111 mg) を得た。ただし精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1) にて行った。

**【0609】****【実施例 V-55】**

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1H-インダゾール-4-イル)フェニル]プロピオン酸 (化合物番号 V-55) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-54 (108 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (400  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-55; 99 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

**【0610】****【実施例 V-57】**

4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-メチルニトロベンゼン (中間体 70) の合成

化合物番号 V-22 の合成法に記載の手順に従って、3-プロモトルエン (WAKO) を公知の方法によりニトロ化して合成した 5-ブromo-2-ニトロトルエン (4.30 g) およびビスピナコレートジボロン (5.59 g)、 $PdCl_2(dppf)$  (440 mg)、酢酸カリウム (6.09 g) をアルゴンガス雰囲気下 80℃ で 3 時間加熱攪拌した。反応混合液に酢酸エチル (300 ml) を加え飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 8:1) で精製し、標記化合物 (中間体 70; 4.21 g) を得た。

**【0611】**

4-(4,4,5,5-テトラメチル-1,3,2-ジオキサボロラン-2-イル)-2-メチルアニリン (中間体 71) の合成



化合物番号Q-2の合成法に記載の手順に従って中間体70 (4.20 g) および酸化白金 (50 mg) を加え水素雰囲気下反応させ処理することにより標記化合物 (中間体71; 2.81 g) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は30分間行った。

【0612】

3- (4'-アミノ-6-シクロペンチルオキシ-3'-メチルピフェニル-3-イル) プロピオン酸メチル (中間体72) の合成

化合物番号C-1の合成法に記載の手順に従って化合物番号A-5 (701 mg)、中間体71 (604 mg)、2M炭酸ナトリウム水溶液 (1.8 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (182 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体72; 762 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は15時間半行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1) にて行った。

【0613】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3- (1H-インダゾール-5-イル) フェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号V-57) の合成

中間体72 (760 mg) の酢酸 (4 ml) 溶液に氷冷下、亜硝酸ナトリウム (156 mg) の水溶液 (0.7 ml) を加え、30分間攪拌した。ここに尿素 (350 mg) を加え室温に昇温し30分間攪拌した後、トルエン (8 ml)、水 (4 ml) を加え、さらに60時間攪拌した。反応混合液をトルエン (50 ml × 2) で抽出し、有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=6:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号V-57; 411 mg) を得た。

【0614】

【実施例V-58】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3- (1H-インダゾール-5-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号V-58) の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-57 (86 mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (250 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号V-58; 82 mg) を得た。ただし反応は2時間半行った。

【0615】

【実施例V-66】

5-ブロモ-3-メチル-1H-インダゾール (中間体73) の合成

化合物番号V-57の合成法に記載の手順に従って4-ブロモ-2-エチルアニリン (5.01 g、LANC)、亜硝酸ナトリウム (1.918 g) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体73; 3.30 g) を得た。ただし反応は121時間行った。

【0616】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3- (3-メチル-1H-インダゾール-5-イル) フェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号V-66) の合成

化合物番号V-22の合成法に記載の手順に従って、化合物番号A-5 (434 mg)、ビスピナコレートジボロン (367 mg)、PdCl<sub>2</sub>(dppf) (101 mg)、酢酸カリウム (339 mg) を80℃で4時間反応させた後、この反応混合液に中間体108 (273 mg)、PdCl<sub>2</sub>(dppf) (104 mg) および2M炭酸ナトリウム水溶液 (1.1 ml) を加え、80℃で18時間反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号V-66; 98 mg) を得た。ただし精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:2) にて行った。

【0617】

【実施例V-67】

3- [4-シクロペンチルオキシ-3- (3-メチル-1H-インダゾール-5-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号V-67) の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-66 (97 mg) および2規定水酸化ナトリウム水溶液 (400 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号V-67; 82 mg) を得た。ただし反応は2時間半行った。

物番号V-67; 54 mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

【0618】

〔実施例V-68〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1,3-ジメチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-68)の合成

化合物番号V-29の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-66(112 mg)、60%水素化ナトリウム(24 mg)、ヨウ化メチル(95  $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体110; 45 mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は16時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて行った。

【0619】

〔実施例V-69〕

3-[4-シクロペンチルオキシ-3-(1,3-ジメチル-1H-インダゾール-5-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号V-69)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-68(45 mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(120  $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-69; 42 mg)を得た。ただし反応は3時間行った。

【0620】

〔実施例V-73〕

3-[3-(ベンゾ[b]チオフェン-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル]プロピオン酸メチル(化合物番号V-73)の合成

化合物番号V-22の合成法に記載の手順に従って、化合物番号A-1(371 mg)、ビスピナコレートジボロン(294 mg)、PdCl<sub>2</sub>(dppf)(67 mg)、酢酸カリウム(308 mg)を80℃で10時間反応させた後、この反応混合液に文献[シード(A. J. Seed)ら、ジャーナル・オブ・マテリアルズ・ケミストリー(J. Mater. Chem.)、2000年、10巻、2069頁]公知の方法で4-プロモチオフェノール(TCI)から得られる5-プロモベンゾ[b]チオフェン(301.4 mg)とPdCl<sub>2</sub>(dppf)(65 mg)および2M炭酸ナトリウム水溶液(0.9 ml)を加え80℃で16時間反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-73; 97 mg)を得た。ただし精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて行った。

【0621】

〔実施例V-74〕

3-[3-(ベンゾ[b]チオフェン-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル]プロピオン酸(化合物番号V-74)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号V-73(95 mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(250  $\mu$ l)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-74; 93 mg)を得た。ただし反応は3時間行った。

【0622】

〔実施例V-77〕

(3-プロモフェニル)チオ尿素(中間体74)の合成

3-プロモアニリン(10.89 ml、TCI)の20%塩酸水溶液(18.2 ml)溶液にチオシアン酸アンモニウム(8.02 g、WAKO)および亜硫酸水素ナトリウム(701 mg、WAKO)を加え100℃にて22時間攪拌した。反応混合液にクロロホルム(20 ml)を加え抽出し有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製し、標記化合物(中間体74; 4.45 g)を得た。

【0623】

2-アミノ-5-プロモベンゾチアゾール(中間体75)の合成

中間体74(1.29 g)のクロロホルム(12 ml)溶液に臭素(272  $\mu$ l、WAKO

O) のクロロホルム溶液 (1.5 ml) を滴下し 2 時間半加熱還流した後、室温にて 16 時間攪拌した。反応混合液を減圧下濃縮し 5% アンモニア水で中和した後、水 (50 ml) および塩化メチレン (150 ml) を加えて抽出した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1) で精製し、標記化合物 (中間体 75; 609 mg) を得た。

## 【0624】

3-[3-(2-アミノベンゾチアゾール-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号 V-77) の合成

中間体 75 (459.1 mg) の無水 THF (30 ml) 溶液に N, N, N', N'-テトラメチルエチレンジアミン (1.51 ml, WAKO) を加えアルゴンガス雰囲気下 78℃ に冷却した後、t-ブチルリチウム/ペンタン 1.62 M 溶液 (7.06 ml) を滴下し 30 分間攪拌した。反応混合液に (iPrO)<sub>3</sub>B (2.77 ml) を滴下し 30 分間攪拌した後、室温に昇温しさらに 1 時間半攪拌した。反応混合液に 0.5 M 硫酸水溶液 (7.5 mL) を加えジエチルエーテル (50 ml × 3) で抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去し粗 2-アミノ-5-ベンゾチアゾールボロン酸を得た。これと化合物番号 A-1 (344 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液 (4.5 ml) および (Ph<sub>3</sub>P)<sub>4</sub>Pd (179 mg) を化合物番号 V-3 の合成法に記載の手順に従って反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-77; 76 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 12 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 2:1) にて行った。

## 【0625】

## 【実施例 V-78】

3-[3-(2-アミノベンゾチアゾール-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-78) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-77 (77 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (380 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-78; 69 mg) を得た。ただし反応は 2 時間半行った。

## 【0626】

## 【実施例 V-79】

3-[3-(ベンゾチアゾール-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル] プロピオン酸エチル (化合物番号 V-79) の合成

化合物番号 V-77 (215 mg) のアセトニトリル (10 ml) 溶液に 30% 次亜リン酸水溶液 (3 ml, WAKO) を加え 0℃ に冷却し、亜硝酸ナトリウム (187 mg) 水溶液 (1 ml) を滴下して 30 分攪拌後、室温に昇温しさらに 20 時間攪拌した。反応混合液を水 (50 ml) に注ぎ 2 規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて中和した後、酢酸エチル (90 ml × 3) を加え抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1) で精製し、標記化合物 (化合物番号 V-79; 78 mg) を得た。

## 【0627】

## 【実施例 V-80】

3-[3-(ベンゾチアゾール-5-イル)-4-シクロペンチルメチルオキシフェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-80) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-79 (75 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (500 μl) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-80; 66 mg) を得た。ただし反応は 2 時間行った。

## 【0628】

## 【実施例 V-81】

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(2-メチルベンゾチアゾール-5-イル)フェニル] プロピオン酸メチル (化合物番号 V-81) の合成

化合物番号 V-13 の合成法に記載の手順に従って 5-ブロモ-2-メチルベンゾチアゾ

ール (684 mg、TCI)、*t*-ブチルリチウム/ペンタン 1.7 M 溶液 (7.06 ml) および  $(i\text{-PrO})_3\text{B}$  (3.46 ml) から調製した粗 2-メチル-5-ベンゾチアゾールボロン酸と化合物番号 A-1 (515 mg)、2 M 炭酸ナトリウム水溶液 (6.5 ml) および  $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$  (258 mg) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-81; 240 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 13 時間行った。精製はフラッシュカラムクロマトグラフィー (ヘキサン: 酢酸エチル = 5:1) にて行った。

## 【0629】

## 〔実施例 V-82〕

3- [4-シクロペンチルメチルオキシ-3- (2-メチルベンゾチアゾール-5-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-82) の合成

中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-81 (227 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (1.11 ml) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-82; 132 mg) を得た。ただし反応は 4 時間行った。

## 【0630】

## 〔実施例 V-83〕

3- {4-シクロペンチルメチルオキシ-3- [2- (N, N-ジメチルアミノ) ベンゾチアゾール-6-イル] フェニル} プロピオン酸エチル (化合物番号 V-83) の合成  
化合物番号 V-29 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-77 (155 mg)、60% 水素化ナトリウム (16 mg) およびヨウ化メチル (68.5  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-83; 48 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は 4 時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 7:1) にて行った。

## 【0631】

## 〔実施例 V-84〕

3- {4-シクロペンチルメチルオキシ-3- [2- (N, N-ジメチルアミノ) ベンゾチアゾール-6-イル] フェニル} プロピオン酸 (化合物番号 V-84) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って化合物番号 V-83 (47 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (200  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-84; 35 mg) を得た。ただし反応は 3 時間行った。

## 【0632】

## 〔実施例 V-88〕

3- [3- (2-プロモベンゾチアゾール-6-イル) -4-シクロヘキシルメチルオキシフェニル] プロピオン酸エチル (中間体 76) の合成  
あらかじめアセトニトリル (10 ml) に亜硝酸 *t*-ブチル (178  $\mu$ l、TCI) および臭化銅 (I) (241 mg、WAKO) を加え混合した溶液に化合物番号 V-83 (381 mg) のアセトニトリル (5 ml) 溶液を滴下し室温にて 1.5 時間攪拌した。反応混合液を減圧下溶媒を濃縮した残渣をカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1) にて精製し、標記化合物 (中間体 76; 341 mg) を得た。

## 【0633】

3- [4-シクロペンチルメチルオキシ-3- (2-メトキシベンゾチアゾール-6-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-88) の合成  
中間体 9 の合成法に記載の手順に従って中間体 76 (169 mg) および 2 規定水酸化ナトリウム水溶液 (500  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (化合物番号 V-88; 114 mg) を得た。ただし反応は 18 時間行った。

## 【0634】

## 〔実施例 V-89〕

3- [4-シクロペンチルメチルオキシ-3- (2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル) フェニル] プロピオン酸 (化合物番号 V-64) の合成  
中間体 76 (202 mg) のエタノール (8 ml) 溶液に 5 規定塩酸水溶液 (1.5 ml

)を加え、80℃で18時間半撈拌した。反応混合液を減圧下濃縮し、水(20ml)および酢酸エチル(80ml)を加え抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。この残渣に2規定水酸化ナトリウム水溶液(1.0ml)を加え、中間体9の合成法に記載の手順に従って反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号V-89; 250mg)を得た。ただし反応は2時間行った。

#### 【0635】

##### 〔実施例V-91〕

3-[4-シクロペンチルメチルオキシ-3-(2-チオキソ-2,3-ジヒドロベンゾチアゾール-6-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号V-91)の合成  
あらかじめチオ尿素(52mg、WAKO)を1M硫酸(5ml)に加え混合した溶液に中間体76(101mg)のアセトニトリル(5ml)溶液を加えて90℃にて20時間撈拌した。反応混合液を水(20ml)に注ぎ、氷冷下1規定水酸化ナトリウム水溶液を加えて中和した後、酢酸エチル(80ml×3)にて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(Quad、塩化メチレン:エタノール=30:1)で精製し、標記化合物(化合物番号V-91; 46mg)を得た。

#### 【0636】

以下に実施例化合物の製造に用いた化合物の合成例を示す。

4-ブロモ-1-メチル-1H-インダゾール(中間体77)および4-ブロモ-2-メチル-2H-インダゾール(中間体78)の合成

化合物番号V-29の合成法に記載の手順に従って中間体69(600mg)、60%水素化ナトリウム(191mg)、ヨウ化メチル(379μl)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体119; 432mgおよび中間体120; 164mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は8時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

#### 【0637】

5-ブロモ-1H-インダゾール(中間体79)の合成

前述の文献[Bioorg. Med. Chem. Lett.、2001年、11巻、1153頁]公知の方法で市販の4-ブロモトルイジン(3.33g、Ald)から標記化合物(中間体121; 0.91g)を得た。

5-ブロモ-1-メチル-1H-インダゾール(中間体80)および5-ブロモ-2-メチル-2H-インダゾール(中間体81)の合成

化合物番号V-29の合成法に記載の手順に従って中間体79(300mg)、60%水素化ナトリウム(80mg)、ヨウ化メチル(161μl)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体80; 201mgおよび中間体81; 87mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は4.5時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

1-メチル-1H-インダゾール-5-ボロン酸(中間体82)の合成

化合物番号V-3の合成法に記載の手順に従って中間体80(1.69g)、n-ブチルリチウム/ヘキサン1.6M溶液(7.50ml)および(<sup>i</sup>PrO)<sub>3</sub>B(3.23ml)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体82; 1.39g)を得た。

#### 【0638】

5-ブロモ-1-エチル-1H-インダゾール(中間体83)および5-ブロモ-2-エチル-2H-インダゾール(中間体84)の合成

化合物番号V-29の合成法に記載の手順に従って中間体79(420mg)、60%水素化ナトリウム(111mg)、ヨウ化エチル(375μl)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体83; 250mgおよび中間体84; 127mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

6-ブロモ-1H-インダゾール(中間体85)の合成

前述の文献[Bioorg. Med. Chem. Lett.、2001年、11巻、1153頁] 公知の方法に準じて市販の5-プロモトルイジン(3.33g、Ald)から標記化合物(中間体85; 0.42g)を得た。

#### 【0639】

6-プロモ-1-メチル-1H-インダゾール(中間体86)および6-プロモ-2-メチル-2H-インダゾール(中間体87)の合成  
化合物番号V-29の合成法に記載の順に従って中間体85(277mg)、60%水素化ナトリウム(86mg)、ヨウ化メチル( $175\mu\text{l}$ )を反応させ処理することにより標記化合物(中間体86; 196mgおよび中間体87; 89mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2.5時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quads、ヘキサン:酢酸エチル=5:1)にて行った。

5-プロモ-2-tert-ブチルチオベンズアルデヒド(中間体88)の合成

5-プロモ-2-フルオロベンズアルデヒド(4.06g、アボカド社製)の2-プロパノール(20ml)溶液に2-メチル-2-プロパントール(2.26ml、Ald)および炭酸カリウム(3.04g)を加え18時間加熱撹拌した。反応混合液を室温まで冷却した後、水(50ml)に注ぎ、クロロホルム( $75\text{ml}\times 3$ )で抽出した。有機層を飽和食塩水で2回洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=20:1)で精製し、標記化合物(中間体88; 754mg)を得た。

#### 【0640】

5-プロモベンゾ[d]イソチアゾール(中間体89)の合成

あらかじめ塩酸ヒドロキシルアミン(308mg、WAKO)の水溶液(5ml)に2規定水酸化ナトリウム水溶液(2.19ml)を混合した溶液を中間体88(401mg)のエタノール(5ml)溶液に室温で15分間かけて滴下した。さらに2時間加熱還流した後、反応混合液を室温まで冷却し水(30ml)に注ぎ酢酸エチル( $100\text{ml}\times 3$ )にて抽出した。有機層を飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣にポリリン酸(21.4g)を加え100℃で2時間加熱撹拌した。反応混合液を氷水(100ml)に注ぎ、氷冷下5規定水酸化ナトリウム水溶液で中和した後、酢酸エチル( $100\text{ml}\times 3$ )にて抽出した。有機層を飽和食塩水で2回洗浄し乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=20:1)で精製し、標記化合物(中間体89; 143mg)を得た。

#### 【0641】

5-プロモベンゾ[c]イソチアゾール(中間体90)の合成

メタンスルホンアミド(5.34g、TCI)の脱水ベンゼン(9ml)溶液に塩化チオニル(6.0ml)を氷冷下加え、24時間加熱還流した。反応混合液を減圧下濃縮した残渣の脱水ベンゼン(4ml)溶液を4-プロモトルイジン(1.49g)の脱水ベンゼン(40ml)溶液に氷冷下滴下した。この混合液にピリジン(0.97ml)の脱水ベンゼン(4ml)溶液を氷冷下滴下し、アルゴンガス雰囲気下80時間加熱還流した。反応混合液を室温まで冷却し、水(100ml)に注ぎクロロホルム( $100\text{ml}\times 3$ )にて抽出した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=10:1)で精製し、標記化合物(中間体90; 618mg)を得た。

#### 【0642】

6-プロモイミダゾ[1,2-a]ピリジン(中間体91)の合成

文献[山中(M. Yamana)ら、ケミカル&ファーマシューティカル・ブルチン(Chem. Pharm. Bull.)、1991年、39巻、1556頁] 公知の方法で市販のプロモアセトアルデヒド-ジエチルアセタール(4.7ml、WAKO)および2-アミノ-5-プロモピリジン(4.32g、Ald)から標記化合物(中間体91; 3.36g)を得た。

5-ブロモ-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン (中間体92) の合成

文献 [D. Mazeasら、ヘテロサイクルス (Heterocycles)、1999年、50巻、1065頁] 公知の方法で市販の1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン (1.3 g、TCI) から標記化合物 (中間体92; 182 mg) を得た。

【0643】

5-ブロモ-1-メチル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン (中間体93) の合成  
化合物番号V-29の合成法に記載の手順に従って中間体92 (98 mg)、60%水素化ナトリウム (33 mg)、ヨウ化メチル (53  $\mu$ l) を反応させ処理することにより標記化合物 (中間体93; 88 mg) を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は2時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー (Quad、ヘキサン:酢酸エチル=15:1) にて行った。

6-プロモイソキノリン (中間体94) の合成

文献 [H. Nerenzら、ジャーナル・オブ・ザ・ケミカル・ソサイエティ・パーキン・トランス2 (J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2)、1998年、437頁] 公知の方法で市販の4-プロモベンズアルデヒド (15.0 g、WAKO) から標記化合物 (中間体94; 1.46 g) を得た。

【0644】

6-ブロモ-2H-イソキノリン-1-オン (中間体95) の合成

中間体94 (1.04 g) の塩化メチレン (3 ml) 溶液に3-クロロ過安息香酸 (2.16 g) の塩化メチレン (10 ml) 溶液を加え20時間攪拌した。反応混合液に塩化メチレン (200 ml) を加え飽和重曹水、飽和塩化アンモニウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄した。有機層を乾燥後、減圧下溶媒を留去した。残渣の無水酢酸 (10 ml) 溶液を5時間加熱還流した。反応混合液を減圧下濃縮した後、残渣に2.5規定水酸化ナトリウム水溶液 (20 ml) を加え、100℃で1時間攪拌した。反応混合液を室温まで冷却し、氷冷下5規定塩酸水にて中和し析出した標記化合物 (中間体95; 623 mg) を得た。

【0645】

〔実施例V-1~115〕

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable-V-1~3に示す。

【0646】

【表 37】

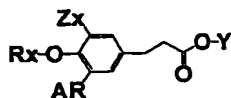


Table-V-1

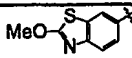
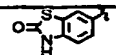
Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
V-1	cHexMeO	Et	H	1-Nap	V-1			
V-2	cHexMeO	H	H	1-Nap	V-2	C		375 (M <sup>+</sup> +1)
V-3	cPenMeO	Me	H	6OH-2-Nap	V-3			
V-4	cPenMeO	H	H	6OH-2-Nap	V-4			
V-5	cPenMeO	Me	H	5OH-2-Nap	V-5			
V-6	cPenMeO	H	H	5OH-2-Nap	V-6			
V-7	cPenMeO	Me	H	7OH-2-Nap	V-7			
V-8	cPenMeO	H	H	7OH-2-Nap	V-8			
V-9	cPenMeO	Me	H	6OMe-2-Nap	V-1			
V-10	cPenMeO	H	H	6OMe-2-Nap	V-2	C		418(M <sup>+</sup> )
V-11	cPenMeO	Me	H	6(OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub> )-2-Nap	V-11			
V-12	cPenMeO	H	H	6(OCH <sub>2</sub> CONMe <sub>2</sub> )-2-Nap	V-12			
V-13	cPenMeO	Me	H	6NH <sub>2</sub> -2-Nap	V-13			
V-14	cPenMeO	H	H	6NH <sub>2</sub> -2-Nap	V-14			
V-15	cPenMeO	H	H	6(NMe <sub>2</sub> )-2-Nap	V-13,V-14	C		418(M <sup>+</sup> +1)
V-16	cPenMeO	H	H	6(NHCOCH <sub>2</sub> OH)-2-Nap	V-16			
V-17	cPenMeO	H	H	6(NHCO-2-Furan)-2-Nap	V-16	C		484(M <sup>+</sup> +1)
V-18	cPenMeO	Me	H	6(NHSO <sub>2</sub> Me)-2-Nap	V-18			
V-19	cPenMeO	H	H	6(NHSO <sub>2</sub> Me)-2-Nap	V-19			
V-20	cPenMeO	Me	H	6(NHSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> )-2-Nap	V-20			
V-21	cPenMeO	H	H	6(NHSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> )-2-Nap	V-21			
V-22	cPenMeO	Me	H	6(NHSO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> )-2-Nap	V-22			
V-23	cPenMeO	H	H	6(NHSO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> )-2-Nap	V-23			
V-24	cPenMeO	H	H	6(SO <sub>2</sub> Me)-2-Nap	V-22,V-23	C		452(M <sup>+</sup> )
V-25	cPenMeO	H	H	6(SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> )-2-Nap	V-22,V-23	C		453(M <sup>+</sup> )
V-26	cPenMeO	H	H	6(SO <sub>2</sub> NHMe)-2-Nap	V-22,V-23	C		468(M <sup>+</sup> +1)
V-27	cPenO	Me	H	5-Ind	V-27			
V-28	cPenO	H	H	5-Ind	V-28			
V-29	cPenO	Me	H	1Me-5-Ind	V-29			
V-30	cPenO	H	H	1Me-5-Ind	V-30			
V-31	cPenMeO	Me	H	4-Ind	V-31			
V-32	cPenMeO	H	H	4-Ind	V-32			
V-33	cPenMeO	Me	H	1Me-4-Ind	V-33			
V-34	cPenMeO	H	H	1Me-4-Ind	V-34			
V-35	cPenMeO	H	H	6-Ind	V-31,V-32	C		377(M <sup>+</sup> )
V-36	cPenMeO	H	H	1-Me-6-Ind	V-33,V-34			
V-37	cPenMeO	H	H	2-Ind	V-31,V-32	A	5.35	364(M <sup>+</sup> +1)
V-38	cPenMeO	H	H	1Me-2-Ind	V-29,V-30			
V-39	cPenMeO	H	H	3-Ind	V-31,V-32			
V-40	cPenMeO	H	H	1Me-3-Ind	V-29,V-30	A	4.75	363(M <sup>+</sup> +1)
V-41	cPenMeO	H	H	1iPr-5-Ind	V-29,V-30	C		405(M <sup>+</sup> )
V-42	cPenMeO	H	H	1cPen-5-Ind	V-29,V-30	C		431(M <sup>+</sup> )
V-43	cPenMeO	H	H	1-(2OHEt)-5-Ind	V-43			

【0647】



【表 38】

Table-V-2

V-44	cPenMeO	Me	H	3CHO-5-Ind	V-44			
V-45	cPenMeO	H	H	3CHO-5-Ind	V-45			
V-46	cPenMeO	H	H	3CHO,1Me-5-Ind	V-29,V-30	C		406(M <sup>+</sup> +1)
V-47	cPenMeO	Me	H	3Ac-5-Ind	V-47			
V-48	cPenMeO	H	H	3Ac-5-Ind	V-48			
V-49	cPenMeO	H	H	3Ac,1Me-5-Ind	V-29,V-30	C		420(M <sup>+</sup> +1)
V-50	cPenMeO	Me	H	3Me-5-Ind	V-50			
V-51	cPenMeO	H	H	3Me-5-Ind	V-51			
V-52	cPenMeO	H	H	1,3DMe-5Ind	V-29,V-30	C		391(M <sup>+</sup> )
V-53	cPenMeO	H	H	1,2,3triMe-5Ind	V-22,V-29,V-30	C		405(M <sup>+</sup> )
V-54	cPenO	Me	H	4-1HIdz	V-54			
V-55	cPenO	H	H	4-1HIdz	V-55			
V-56	cPenO	H	H	1Me-4-1HIdz	V-29,V-30			
V-57	cPenO	Me	H	5-1HIdz	V-57			
V-58	cPenO	H	H	5-1HIdz	V-58			
V-59	cPenO	H	H	1Me-5-1HIdz	V-29,V-30			
V-60	cPenO	H	H	1Et-5-1HIdz	V-29,V-30			
V-61	cPenO	H	H	1Pr-5-1HIdz	V-29,V-30			
V-62	cPenO	H	H	2Me-5-2HIdz	V-29,V-30			
V-63	cPenMeO	H	H	6-1HIdz	V-57,V-58			
V-64	cPenMeO	H	H	1Me-6-1HIdz	V-29,V-30			
V-65	cPenMeO	H	H	1Et-5-1HIdz	V-29,V-30			
V-66	cPenO	Me	H	3Me-5-1HIdz	V-66			
V-67	cPenO	H	H	3Me-5-1HIdz	V-67			
V-68	cPenO	Me	H	1,3DMe-5-1HIdz	V-68			
V-68	cPenO	H	H	1,3DMe-5-1HIdz	V-69			
V-69	cPenO	H	H	3(CHO)-5-1HIdz	V-22,V-23			
V-70	cPenO	H	H	3(CHO),1Me-5-1HIdz	V-22,V-23	A	4.38	365(M <sup>+</sup> +1)
V-71	cPenO	H	H	3OH-5-1HIdz	V-22,V-23			
V-72	cPenO	H	H	3OH,1Me-5-1HIdz	V-22,V-23	A	3.71	381(M <sup>+</sup> +1)
V-73	cPenMeO	Me	H	5-BT	V-73			
V-74	cPenMeO	H	H	5-BT	V-74			
V-75	cPenMeO	H	H	5-BF	V-22,V-23	C		378(M <sup>+</sup> )
V-76	cPenMeO	H	H	2,3DMe-5-BF	V-22,V-23	C		406(M <sup>+</sup> )
V-77	cPenMeO	Me	H	5-2ABzt	V-77			
V-78	cPenMeO	H	H	5-2ABzt	V-78			
V-79	cPenMeO	Et	H	5-Bzt	V-79			
V-80	cPenMeO	H	H	5-Bzt	V-80			
V-81	cPenMeO	Me	H	2Me-5-Bzt	V-81			
V-82	cPenMeO	H	H	2Me-5-Bzt	V-82			
V-83	cPenMeO	Et	H	2,2DMe-5-2ABzt	V-83			
V-84	cPenMeO	H	H	2,2DMe-5-2ABzt	V-84			
V-85	cPenMeO	H	H	6-2ABzt	V-77,V-78	C		397(M <sup>+</sup> +1)
V-86	cPenMeO	H	H	6-Bzt	V-79,V-80	C		453(M <sup>+</sup> +1)
V-87	cPenMeO	H	H	2Me-6-Bzt	V-81,V-82	C		410(M <sup>+</sup> +1)
V-88	cPenMeO	H	H		V-88			
V-89	cPenMeO	H	H		V-89			

【0648】

【表 39】

Table-V-3

V-90	cPenMeO	H	H		V-29,V-30	C		412(M <sup>+</sup> +1)
V-91	cPenMeO	H	H		V-91	C		414(M <sup>+</sup> +1)
V-92	cPenMeO	H	H		V-29,V-30	C		425(M <sup>+</sup> +1)
V-93	cPenO	H	H		V-22,V-23	B	3.87	368(M <sup>+</sup> +1)
V-94	cPenO	H	H		V-22,V-23	B	3.58	368(M <sup>+</sup> +1)
V-95	cPenO	H	H		V-22,V-23	A	2.57	315(M <sup>+</sup> +1)
V-96	cPenO	H	H		V-22,V-23	A	3.84	351(M <sup>+</sup> +1)
V-97	cPenO	H	H		V-29,V-30	A	4.28	365(M <sup>+</sup> +1)
V-98	cPenMeO	H	H	3-Qu	V-22,V-23	C		376(M <sup>+</sup> +1)
V-99	cPenMeO	H	H	6-Qu	V-22,V-23	C		376(M <sup>+</sup> +1)
V-100	cPenO	H	H	6-IQ	V-22,V-23	A	2.15	452(M <sup>+</sup> +1)
V-101	cPenO	H	H		V-22,V-23	A	3.74	378(M <sup>+</sup> +1)
V-102	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		378(M <sup>+</sup> +1)
V-103	cHexMeO	Et	H		V-33	C		406(M <sup>+</sup> )
V-104	cHexMeO	H	H		V-34	C		378(M <sup>+</sup> +1)
V-105	cHexMeO	Et	H		V-33	C		422(M <sup>+</sup> )
V-106	cHexMeO	H	H		V-34	C		394(M <sup>+</sup> )
V-107	cHexMeO	H	H		V-22,V-23	C		455(M <sup>+</sup> +1)
V-108	cHexMeO	H	H		V-22,V-23	C		495(M <sup>+</sup> +1)
V-109	cHexMeO	H	H		V-22,V-23	C		487(M <sup>+</sup> +1)
V-110	cPenO	H	H	3(COOH),1Me-7-1HIdz	V-22,V-23	A	3.99	409(M <sup>+</sup> +1)
V-111	cPenO	H	H	3(COOH),1Me-5-1HIdz	V-22,V-23	A	3.75	409(M <sup>+</sup> +1)
V-112	cPenO	H	H	3(COOH),2Me-5-2HIdz	V-22,V-23	A	3.96	409(M <sup>+</sup> +1)
V-113	cPenO	H	H	3(COOH),2Me-7-2HIdz	V-22,V-23	A	3.80	409(M <sup>+</sup> +1)
V-114	cPenO	H	H	3(COOH)-7-1HIdz	V-22,V-23	A	3.66	395(M <sup>+</sup> +1)
V-115	cPenO	H	H	3(COOH)-5-1HIdz	V-22,V-23	A	3.49	395(M <sup>+</sup> +1)

## 【実施例 W-1 ~ 25】

6-プロモシンノリン (中間体 96) の合成

文献 [D. Kimballら、オーガニック・レター (Organic Letter)、2000年、3825頁] 公知の方法で市販の4-プロモ-2-ヨードアニリン (711mg、Ald) から標記化合物 (中間体 96; 134mg) を得た。

7-プロモキナゾリン (中間体 97) の合成

文献 [B. Dalbyら、シンセシス (Synthesis)、2002年、83頁] 公知の方法で市販のキナゾリン (2.11g、WAKO) から標記化合物 (中間体 97; 921mg) を得た。

## 【0649】

本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例を Table-W-1 ~ 2 に示す。

【0650】

【表40】

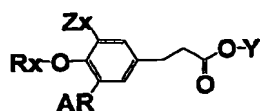


Table-W-1

Exp.	RxO	Y	Zx	AR	Syn	LCMS		
						method	RTime	Mass
W-1	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		366(M <sup>+</sup> +1)
W-2	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		383(M <sup>+</sup> +1)
W-3	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		365(M <sup>+</sup> +1)
W-4	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		380(M <sup>+</sup> +1)
W-5	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		366(M <sup>+</sup> +1)
W-6	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		380(M <sup>+</sup> +1)
W-7	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		381(M <sup>+</sup> +1)
W-8	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		398(M <sup>+</sup> +1)
W-9	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		382(M <sup>+</sup> +1)
W-10	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		366(M <sup>+</sup> +1)
W-11	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		377(M <sup>+</sup> +1)
W-12	cPenO	H	H		V-22,V-23	A	3.97	363(M <sup>+</sup> +1)
W-13	cPenO	H	H		V-22,V-23	A	4.06	363(M <sup>+</sup> +1)
W-14	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		380(M <sup>+</sup> +1)
W-15	cPenO	H	H		V-22,V-23	C		355(M <sup>+</sup> +1)
W-16	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		397(M <sup>+</sup> +1)
W-17	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		381(M <sup>+</sup> +1)
W-18	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		380(M <sup>+</sup> +1)

【0651】

【表 4 1】

Table-W-2

W-19	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		381(M <sup>+</sup> +1)
W-20	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		398(M <sup>+</sup> +1)
W-21	cPenMeO	H	H		V-22,V-23	C		382(M <sup>+</sup> +1)
W-22	cPenO	H	H		V-22,V-23	C		351(M <sup>+</sup> +1)
W-23	cPenO	H	H		V-22,V-23	C		353(M <sup>+</sup> +1)
W-24	cPenO	H	H		V-22,V-23	C		353(M <sup>+</sup> +1)
W-25	cPenO	H	H		V-22,V-23	C		367(M <sup>+</sup> +1)

## 【実施例 X-1】

3-[2-シクロペンチルオキシ-5-(ナフタレン-2-イル)フェニル]アクリル酸エチル(中間体98)の合成

中間体7の合成法に記載の手順に従って化合物番号D-20(396mg)、ジエチルホスホ酢酸エチル(288μl)、60%水素化ナトリウム(59mg)を反応させ処理することにより標記化合物(中間体98;428mg)を得た。ただし反応は1時間行った。

3-[2-シクロヘキシルメチルオキシ-5-(ナフタレン-1-イル)フェニル]プロピオン酸エチル(化合物番号X-1)の合成

中間体B-99の合成法に記載の手順に従って中間体98(361mg)およびラネー2800ニッケル(380mg)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号X-1;397mg)を得た。ただし以下の変更を加えた。反応は50℃にて5時間行った。精製はカラムクロマトグラフィー(Quad、ヘキサン:酢酸エチル=10:1)にて行った。

【0652】

## 【実施例 X-2】

3-[2-シクロヘキシルメチルオキシ-5-(ナフタレン-1-イル)フェニル]プロピオン酸(化合物番号X-2)の合成

中間体9の合成法に記載の手順に従って化合物番号X-1(390mg)および2規定水酸化ナトリウム水溶液(1.1ml)を反応させ処理することにより標記化合物(化合物番号X-2;338mg)を得た。ただし反応は2.5時間行った。】

## 【実施例 X-1~4】

上記の実施例を含め、本発明に記載のいずれかの方法を用いて、対応する原料化合物を反応し、処理することで得られる本発明の化合物の代表例をTable-X-1に示す。

【0653】

【表 4 2】

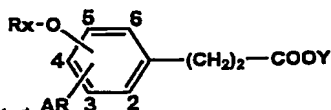


Table-X-1

Exp.	RxO	Y	RxO position	AR	Syn	AR position	LCMS		
							method	RTime	Mass
X-1	cPenO	Et	2	2-Nap	X-1	5			
X-2	cPenO	H	2	2-Nap	X-2	5	C		347(M <sup>+</sup> +1)
X-3	cPenO	H	2	1Me-5-Ind	X-1,X-2	5	C		350(M <sup>+</sup> +1)
X-4	cPenO	H	2	1Me-5-1Hidz	X-1,X-2	5	C		351(M <sup>+</sup> +1)

## 【試験例】

1. IL-1β刺激MG-63細胞からのPGE<sub>2</sub>産生抑制作用

## (1) 測定方法

炎症性の刺激物質であるインターロイキン (IL) -  $1\beta$  による  $\text{PGE}_2$  産生に対する抑制作用を以下の方法で調べた。ヒト骨肉腫細胞株である MG-63 細胞 (大日本製薬より購入) を 10% 牛胎児血清 (BioFluid 社製) を含む MEM 培地 (GIBCO 社製) に懸濁して 96 ウェル培養プレートに  $2 \times 10^4$  細胞/ウェルになるように播種した後一晩培養し、0.5% 牛胎児血清を含む MEM 培地に交換し、被験化合物をウェルに加え、さらに炎症性の刺激剤としてヒトインターロイキン- $1\beta$  (ENDOGEN 社製) を  $1 \text{ ng/ml}$  になるように加えた。さらに 18 時間培養した後、培養上清を回収し、培養上清中の  $\text{PGE}_2$  濃度を EIA kit (CAYMAN 社製) を用いて測定した。刺激剤を加えないウェルを陰性対照とし、刺激剤だけを加えたウェルを陽性対照として、被験化合物を加えたウェルの  $\text{PGE}_2$  産生量から  $\text{PGE}_2$  産生抑制率を以下の数式により計算して求めた。

【0654】

【数1】

$$\text{PGE}_2 \text{産生抑制率 (\%)} = \left[ 1 - \frac{C - B}{A - B} \right] \times 100$$

A: 陽性対照の  $\text{PGE}_2$  産生量B: 陰性対照の  $\text{PGE}_2$  産生量C: 被験化合物添加ウェルの  $\text{PGE}_2$  産生量

また化合物の細胞障害作用について上清回収後の細胞を用いてメチレンブルー取り込み法により調べた。すなわち上清回収後の細胞をグルタルアルデヒドで固定し、0.05% メチレンブルー溶液で染色した後、細胞に取り込まれたメチレンブルーを 0.3 N 塩酸で抽出し、抽出液の 670 nm の吸光度を測定した。上記陽性対照のウェルの吸光値を 100% として被験化合物のウェルの吸光値が 80% 未満になるときを被験化合物に細胞障害作用陽性と判定した。

【0655】

## (2) 測定結果

被験化合物 (化合物番号 G-1~121、H-1~32、J-1~92、K-1~40、L-1~95、M-1~32、N-1~74、P-1~50、Q-1~52、S-1~73、T-1~61、U-1~18、V-1~109 及び W-1~13 は、IL- $1\beta$  による  $\text{PGE}_2$  の産生を  $1.0 \mu\text{M}$  で 50% 以上抑制した。またこの濃度ではいずれの被験化合物も細胞障害作用は示さなかった。

従って、本発明の新規な置換フェニルアルカン酸誘導体またはその塩は、炎症性のプロスタグランジン産生に対する抑制薬として有用である。

【0656】

2. IgE 刺激 RBL-2H3 細胞からの  $\text{PGD}_2$  および  $\text{LTB}_4$  の産生抑制作用

## (1) 測定方法

アレルギー性の刺激剤である IgE 抗体による  $\text{PGD}_2$  および  $\text{LTB}_4$  の産生に対する抑制作用を以下の方法で調べた。ラットマストサイトーマ株である RBL-2H3 細胞 (ATCC より購入) を 10% 牛胎児血清 (BioFluid 社製) を含む DEMEM 培地 (GIBCO 社製) に懸濁して 48 ウェル培養プレートに  $2 \times 10^4$  細胞/ウェルになるように播種した後一晩培養し、ジニトロフェニル化 BSA (以下、DNP-BSA) に対する IgE 抗血清を加えて 30 分間培養した後、0.5% 牛胎児血清を含む DEMEM 培地に交換し、被験化合物をウェルに加え、さらに刺激剤として DNP-BSA を  $100 \text{ ng/ml}$  になるように加えた。刺激剤を加えた 10 分後に培養上清を回収し、培養上清中の  $\text{PGD}_2$  濃度および  $\text{LTB}_4$  濃度をそれぞれ EIA kit (CAYMAN 社製) を用いて測定した。刺激剤を加えないウェルを陰性対照とし、刺激剤だけを加えたウェルを陽性対照と

して、被験化合物を加えたウェルのメディエーター産生量からメディエーター産生抑制率を以下の数式 2 により計算して求めた。

【0657】

【数 2】

$$\text{PGD}_2\text{またはLTB}_4\text{産生抑制率 (\%)} = \left[ 1 - \frac{C - B}{A - B} \right] \times 100$$

A: 陽性対照の PGD<sub>2</sub> または LTB<sub>4</sub> 産生量

B: 陰性対照の PGD<sub>2</sub> または LTB<sub>4</sub> 産生量

C: 被験化合物添加ウェルの PGD<sub>2</sub> または LTB<sub>4</sub> 産生量

化合物の細胞障害作用については上記と同様に上清回収後の細胞を用いてメチレンブルー取り込み法により調べた。

【0658】

(2) 測定結果

本明細書に記載した目的化合物 (I) の代表的化合物は、I g E 刺激による PGD<sub>2</sub> および LTB<sub>4</sub> の産生を 1.0 μM で 50% 以上抑制した。またこの濃度ではいずれの被験化合物も細胞障害作用は示さなかった。従って、本発明の新規な置換フェニルアルカン酸誘導体またはその塩は、アレルギー性のプロスタグランジンおよびロイコトリエン産生に対する抑制作用を示し、それらの産生抑制薬として有用である。

【0659】

3. マウスザイモザン刺激足浮腫反応に対する抑制効果

(1) 測定方法

炎症性の刺激剤であるザイモザンによる足浮腫に対する抑制効果を以下の方法で調べた。ICR 雌性マウス (6~7 週齢) を一群 8 匹として試験に用いた。被験化合物を 0.5% メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に 0.1~500 mg/10 ml/kg になるように経口投与した。対照群には被験化合物無添加の 0.5% メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。被験化合物投与 1 時間後にマウス右後肢の足蹠皮下に生理食塩水 (大塚製薬工場製) に 1 mg/ml になるように懸濁したザイモザン液を 0.02 ml 投与した。ザイモザン液を投与してから 1 および 2 時間後に右後肢の足蹠の容積をマウス後肢足浮腫容積測定装置 (ユニコム社製) を用いて測定した。このときの足蹠の容積とあらかじめ測定しておいた被験化合物投与前の足蹠容積との差を浮腫容積とした。

ザイモザン投与後 1 時間および 2 時間の浮腫容積について、横軸を時間および縦軸を浮腫容積としてプロットしたグラフを作成し、以下の数式により 2 時間までの浮腫容積 AUC (エリア・アンダー・ザ・カーヴ) を計算して求めた。

【0660】

【数 3】

$$\text{浮腫容積 AUC } (\mu\text{l} \cdot \text{時間}) = 1/2 \times 1 \times A + 1 \times (A+B) / 2$$

A: ザイモザン投与 1 時間目の浮腫容積

B: ザイモザン投与 2 時間目の浮腫容積

被験化合物による浮腫の抑制率は以下の数式により計算して求めた。

【0661】

## 【数 4】

$$\text{浮腫抑制率 (\%)} = \left[ 1 - \frac{B}{A} \right] \times 100$$

A: 陽性対照の浮腫容積AUC

B: 被験化合物投与群の浮腫容積AUC

## (2) 測定結果

本明細書に記載した目的化合物 (I) の代表的化合物は、ザイモザン皮下投与による足浮腫を 0.1~500mg/kg の経口投与で陽性対照群に比べ抑制した。

従って、本発明である新規な置換フェニルアルカン酸誘導体またはその塩は、炎症性の刺激剤であるザイモザンによる足浮腫に対して抑制作用を示すことから炎症性疾患の予防および/または治療薬として有用である。

## 【0662】

## 4. マウス IgE 刺激足浮腫反応に対する抑制効果

## (1) 測定方法

アレルギー性の刺激剤である IgE 抗体による足浮腫に対する抑制を以下の方法で調べた。C57BL/6 雄性マウス (9~11 週齢) を一群 5 匹として試験に用いた。前日に抗 DNP-BSA IgE 血清を 20 μl マウスの右後肢足蹠に皮下投与した。被験化合物を 0.5% メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に 0.1~500mg/10ml/kg になるように経口投与した。対照群には被験化合物無添加の 0.5% メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。被験化合物投与 2 時間後に生理食塩水 (大塚製薬工場製) に 2.5 μg/ml になるように溶解した DNP-BSA 溶液 0.2ml を静脈内に投与した。DNP-BSA を投与してから 10 分、15 分、20 分および 30 分後に右後肢の足蹠の厚さをデジタルチックネスゲージ (MITSUTOYO 社製) を用いて測定した。このときの足蹠の厚さとあらかじめ測定しておいた被験化合物投与前の厚さとの差を浮腫厚とした。

DNP-BSA 投与後 10 分、15 分、20 分および 30 分後の浮腫厚について、横軸を時間および縦軸を浮腫厚としてプロットしたグラフを作成し、以下の数式により 2 時間までの浮腫厚 AUC を計算して求めた。

## 【0663】

## 【数 5】

$$\text{浮腫厚 AUC (mm} \cdot \text{分)} = 1/2 \times 10 \times A + 5 \times (A+B) / 2 + 5 \times (B+C) / 2 + 10 \times (C+D) / 2$$

A: DNP-BSA 投与 10 分目の浮腫厚

B: DNP-BSA 投与 15 分目の浮腫厚

C: DNP-BSA 投与 20 分目の浮腫厚

D: DNP-BSA 投与 30 分目の浮腫厚

被験化合物による浮腫の抑制率は以下の数式により計算して求めた。

## 【0664】

## 【数6】

$$\text{浮腫抑制率 (\%)} = \left[ 1 - \frac{B}{A} \right] \times 100$$

A: 陽性対照の浮腫厚AUC

B: 被験化合物投与群の浮腫厚AUC

## (2) 測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、IgE刺激による足浮腫すなわち抗DNP-BSA IgE血清で感作したマウスにDNP-BSAを投与したときにおける足浮腫を0.1~500mg/kgの経口投与で陽性対照群に比べ抑制した。従って、本発明である新規な置換フェニルアルカン酸誘導体またはその塩は、アレルギー性の刺激剤であるIgE抗体による足浮腫に対して抑制作用を示すことからアレルギー性疾患の予防および/または治療薬として有用である。

## 【0665】

## 5. マウス酢酸ライジング反応に対する抑制効果

## (1) 測定方法

急性疼痛のモデルである酢酸ライジング反応に対する抑制効果を以下の方法で調べた。ICR雌性マウス(6週齢)を一群8匹として試験に用いた。被験化合物を0.5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に0.1~500mg/10ml/kgになるように経口投与した。対照群には被験化合物無添加の0.5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。被験化合物を投与して1時間後にマウスの腹腔内に0.9%酢酸水を5ml/kgになるように投与し、酢酸水投与直後から15分間のライジング回数を数えた。対照群に対する抑制率を以下の数式を用いて計算して求めた。

## 【0666】

## 【数7】

$$\text{ライジング抑制率 (\%)} = \left[ 1 - \frac{B}{A} \right] \times 100$$

A: 陽性対照群のライジング回数

B: 被験化合物投与群のライジング回数

## (2) 測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、酢酸水投与によるライジングを0.1~500mg/kgの経口投与で陽性対照群に比べ抑制した。

酢酸を腹腔内に投与したときに起きるライジング反応は、プロスタグランジンの産生によって起こることが明らかにされている[Matsumotoら、ヨーロッパ・ジャーナル・オブ・ファーマコロジー(Eur. J. Pharmacol)、1998年、352巻、47頁]、[Uenoら、バイオケミカル・ファーマコロジー(Biochem. Pharmacol)、2001年、15巻、157頁]。

従って、本発明である新規な置換フェニルアルカン酸誘導体またはその塩は、プロスタグランジンによって起こる急性疼痛の予防および/または治療薬として有用である。

## 【0667】

## 6. ラットアジュバント関節炎に対する予防および治療効果

## (1) 測定方法

自己免疫性疾患の一つでありまた慢性炎症疾患である慢性関節リウマチの病態モデルであ



るラットアジュバント関節炎における足浮腫に対する抑制効果を以下の方法で調べた。Lewis 雌性ラット（8週令）を一群6匹として試験に用いた。試験動物右後肢足蹠皮下にアジュバントとしてM. tuberculosis H37 RA（DIFCO社製）を10mg/ml含む流動パラフィン50 $\mu$ l投与して免疫した。被験化合物を0.5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁または溶解し、試験動物に0.1~500mg/5ml/kgになるように経口投与した。投与は免疫後12日目から一日2回、14日間投与を行った。対照群には被験化合物無添加の0.5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。アジュバントを投与してから2または3日おきにアジュバントを投与していない左後肢の足蹠の容積をラット後肢足浮腫容積測定装置（ユニコム社製）を用いて測定した。浮腫抑制率は以下の数式を用い計算して求めた。

【0668】

【数8】

$$\text{浮腫抑制率 (\%)} = \left[ 1 - \frac{(D - C) / C}{(B - A) / A} \right] \times 100$$

A: アジュバント投与直前の陽性対照の左後肢足蹠容積

B: 各測定日における陽性対照の左後肢足蹠容積

C: アジュバント投与直前の被験化合物投与群の左後肢足蹠容積

D: 各測定日における被験化合物投与群の左後肢足蹠容積

## (2) 測定結果

本明細書に記載した目的化合物(I)の代表的化合物は、アジュバント関節炎における足浮腫に対し陽性対照群に比べて抑制した。

従って、本発明である新規な置換フェニルアルカン酸誘導体またはその塩は、慢性関節リウマチの、また自己免疫性疾患の予防および/または治療薬として有用である。

【0669】

## 7. ラット肺線維症に対する効果

## (1) 測定方法

肺線維症の病態モデルであるブレオマイシン誘発ラット肺線維症モデルにおける肺線維化抑制効果について以下の方法で調べた。BN雌性ラット（7週令）を一群7匹として試験に用いた。試験動物をケタミン及びキシラジンで麻酔して気管を露出し、気管内に生理食塩水（大塚製薬工場製）に溶解した125 $\mu$ g/0.1mlのブレオマイシン（日本化薬）溶液を注射器を用いて注入した。陰性対照群には0.1mlの生理食塩水を気管内に投与した。

【0670】

被験化合物を0.5%メチルセルロースを含む精製水に懸濁又は溶解し、試験動物に10mg、30mg、100mg又は300mg/5ml/kgになるように経口投与した。被験化合物の投与はブレオマイシンを投与した日から一日1回から2回、21日間行った。陽性対照群には被験化合物無添加の0.5%メチルセルロースを含む精製水を同様に投与した。ブレオマイシンを投与してから21日目にラットを犠牲死させ、肺を中性緩衝ホルマリンで固定し、病理組織標本を作製した。病理組織標本の染色はアザン法で行った。

肺の組織標本の観察を行い、肉芽組織形成と膠原線維増生を指標として線維化の程度を次のようにスコア化した。すなわち、-: 異常なし、+: ごく軽度の変化、++: 軽度の変化、+++ : 中等度の変化、++++: 高度の変化、とした。

【0671】

## (2) 測定結果

陰性対照群の線維化スコアは-であり、肺の線維化は認められなかった。陽性対照群の線

維化スコアの中央値は++~+++であり、肺の線維化が認められた。被験化合物（化合物番号；G-2、G-4 及び V-40）を投与した群の肺の線維化スコアの中央値は、+から++であり、陽性対照群に比べて線維化が軽度であった。従って、本発明化合物は肺線維症の予防及び／又は治療薬として有用であり、また 4 型 PLA<sub>2</sub> 阻害化合物は肺線維症の予防及び／又は治療薬として有用である（進行防止剤を含む）。

また、同様に、公知の c PLA<sub>2</sub> 阻害化合物であるアラキドニルトリフルオロメチルケトン、4-（1-ベンズヒドリル-6-クロロ-1H-インドール-3-イルメチル）-3-メトキシ安息香酸、N- {1- [2-（2, 4-ジフルオロベンゾイル）ベンゾイル]-4-トリチルスルファニルピロリジン-2-イルメチル} -4-（2, 4-ジオキソチアゾリジン-5-イリデンメチル）安息香酸アミド又は 4- {4- [2-（2- [ビス（4-クロロフェニル）メトキシ] エチルスルホニル）エトキシ] フェニル} -1, 1, 1-トリフルオロ-2-ブタノンを経口投与又は腹腔内投与する。これらの公知の 4 型 PLA<sub>2</sub> 阻害化合物を投与した群においても線維化が軽度である。

#### 【産業上の利用可能性】

#### 【0672】

本発明の化合物は優れたプロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有しており、これらの脂質メディエーターに起因する各種の炎症性疾患、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患、疼痛、線維症などの予防及び／又は治療のための医薬の有効成分として好適に利用できる。

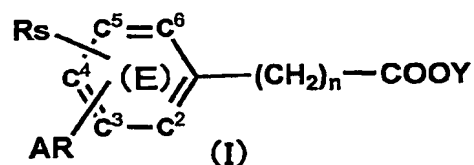
【書類名】要約書

【要約】

【課題】 プロスタグランジン産生抑制作用及びロイコトリエン産生抑制作用を有する化合物を提供する。

【解決手段】 一般式 (I) :

【化 1】



〔式中、 $n$  は 1 ～ 3 の何れかの整数を示し、芳香環 (E) 上の  $C^2 \sim C^6$  は環構成炭素原子を示し、上記環構成炭素原子のうちのいずれか 1 個は  $V$  で置き換えられていてもよく、 $V$  は窒素原子又は  $Z_x$  で置換された炭素原子を示し、 $Z_x$  は炭素数 1 ～ 4 個の飽和アルキル基などを示し、 $R_s$  は  $-D-R_x$  などを示し、 $D$  は単結合又は酸素原子などを示し、 $R_x$  は炭素数 3 ～ 8 個の飽和アルキル基などを示し、 $AR$  は部分不飽和又は完全不飽和である縮合二環式の炭素環又は複素環を示し、 $Y$  は水素原子又は炭素数 1 ～ 4 個の低級アルキル基などを示す〕で表される化合物又はその塩。

【書類名】 出願人名義変更届 (一般承継)  
【提出日】 平成15年10月 1日  
【あて先】 特許庁長官 殿  
【事件の表示】  
    【出願番号】 特願2003-293590  
【承継人】  
    【識別番号】 303046299  
    【氏名又は名称】 旭化成ファーマ株式会社  
    【代表者】 中岡 靖晶  
【提出物件の目録】  
    【物件名】 商業登記簿謄本 1  
    【援用の表示】 平成 0 4 年特許願第 1 5 4 5 9 4 号  
    【物件名】 承継証明書 1  
    【援用の表示】 平成 0 4 年特許願第 1 5 4 5 9 4 号

特願 2 0 0 3 - 2 9 3 5 9 0

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[ 0 0 0 0 0 0 0 3 3 ]

1. 変更年月日

2 0 0 1 年 1 月 4 日

[変更理由]

名称変更

住 所

大阪府大阪市北区堂島浜 1 丁目 2 番 6 号

氏 名

旭化成株式会社

特願 2003-293590

出願人履歴情報

識別番号

[303046299]

1. 変更年月日

2003年 8月20日

[変更理由]

新規登録

住所

東京都千代田区神田美土代町9番地1

氏名

旭化成ファーマ株式会社